

PC-9267 15R 1/5

国際調査報告で挙げられた文献

(19) 日本国特許庁 (J P)

# (12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

第157

特開平9-255659

(43) 公開日 平成9年(1997)9月30日

(51) Int. Cl. <sup>6</sup>	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
C07D215/38			C07D215/38	
A61K 31/47	ABF		A61K 31/47	ABF
C07D215/22			C07D215/22	

審査請求 未請求 請求項の数37 O L (全53頁)

(21) 出願番号 特願平8-270866

(22) 出願日 平成8年(1996)10月14日

(31) 優先権主張番号 特願平8-5449

(32) 優先日 平8(1996)1月17日

(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(71) 出願人 000002886

大日本インキ化学工業株式会社

東京都板橋区坂下3丁目35番58号

(72) 発明者 高垣 秀次

千葉県佐倉市六崎826-18

(72) 発明者 阿部 真好

千葉県千葉市緑区あすみが丘5-29-4

(72) 発明者 酒井 充

千葉県佐倉市石川28-2ハイメゾン102

(72) 発明者 青木 康夫

千葉県四街道市和良比772グランリオ201

(74) 代理人 弁理士 高橋 勝利

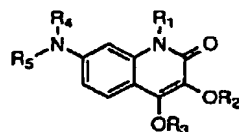
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 キノリノン誘導体及びそれを有効成分とする抗アレルギー剤

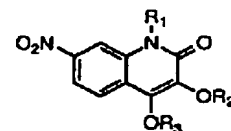
(57) 【要約】 (修正有)

【課題】 新規なニトロキノリノン誘導体、該ニトロキノリノン誘導体から合成されるアミノキノリノン誘導体及びその生理学的に許容される塩、更に、該アミノキノリノン誘導体及びその生理学的に許容される塩を有効成分とする、優れた抗アレルギー剤を提供する。

【解決手段】 一般式 (I)



る、一般式 (I I)



で表されるキノリノン誘導体。

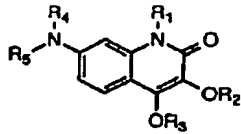
(式中、R<sub>1</sub>は水素原子、又はアルキル基であり、R<sub>2</sub>及びR<sub>3</sub>は、各々、水素原子、アシル基、アルキル基、又はアルケニル基から選ばれる基であり、R<sub>4</sub>とR<sub>5</sub>は同一もしくは異なって、各々、水素原子、アシル基、アルキル基、アルケニル基、又はアラルキル基から選ばれる基である。) で表されるキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩、及びそれらを有効成分とする抗アレルギー剤、及び該キノリノン誘導体の合成中間体であ

1

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式(1)

【化1】



(式中、R<sub>1</sub>は水素原子、又はアルキル基であり、R<sub>2</sub>とR<sub>3</sub>とは互いに異なり、各々、水素原子、アシル基、アルキル基、又はアルケニル基から選ばれる基であり、R<sub>4</sub>とR<sub>5</sub>は同一もしくは異なって、各々、水素原子、アシル基、アルキル基、アルケニル基、又はアラルキル基から選ばれる基である。)で表される7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項2】 R<sub>1</sub>が水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基である請求項1に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項3】 R<sub>2</sub>とR<sub>3</sub>が各々、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である請求項1に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項4】 R<sub>4</sub>とR<sub>5</sub>が同一もしくは異なって、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である請求項1に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項5】 R<sub>1</sub>が水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基であり、R<sub>2</sub>とR<sub>3</sub>が各々、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基であり、R<sub>4</sub>とR<sub>5</sub>が同一もしくは異なって、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である請求項1~4のいずれか一つに記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項6】 R<sub>1</sub>が水素原子であり、R<sub>2</sub>が直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である請求項5に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項7】 R<sub>1</sub>がアシル基であり、R<sub>2</sub>が水素原子である請求項5に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項8】 R<sub>1</sub>がアシル基であり、R<sub>2</sub>が直鎖状もし

2

くは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である請求項5に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項9】 R<sub>1</sub>が直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基であり、R<sub>2</sub>が水素原子である請求項5に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項10】 R<sub>1</sub>が直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基であり、R<sub>2</sub>がアシル基である請求項5に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項11】 R<sub>2</sub>とR<sub>3</sub>が互いに異なる直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である請求項5に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項12】 R<sub>4</sub>が水素原子であり、R<sub>5</sub>が水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である請求項6~11のいずれか一つに記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項13】 R<sub>1</sub>がアシル基である請求項12に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

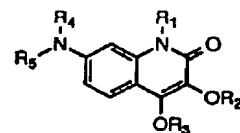
【請求項14】 R<sub>1</sub>が置換基を有しても良いシンナモイル基からなるアシル基である請求項13に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項15】 R<sub>1</sub>が4-ヒドロキシ-3-メトキシシンナモイル基、又は、3,5-ジメトキシ-4-ヒドロキシシンナモイル基である請求項14に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項16】 請求項1~15のいずれか一つに記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩を有効成分とする抗アレルギー剤。

【請求項17】 一般式(1)

【化2】



(式中、R<sub>1</sub>は水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基であり、R<sub>2</sub>とR<sub>3</sub>は同一、水素原子、アルキル基、又はアルケニル基であ

り、 $R_1$ と $R_2$ は同一もしくは異なって、水素原子、アシル基、アルキル基、アルケニル基、又はアラルキル基である。)で表される7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項18】  $R_1$ と $R_2$ が水素原子、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である請求項17に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項19】  $R_1$ と $R_2$ が同一もしくは異なって、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である請求項17に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項20】  $R_1$ と $R_2$ が水素原子、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基であり、 $R_1$ と $R_2$ が同一もしくは異なって、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である請求項17~19のいずれか一つに記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項21】  $R_1$ と $R_2$ が水素原子である請求項20に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項22】  $R_1$ と $R_2$ が直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である請求項20に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項23】  $R_1$ が水素原子であり、 $R_2$ が水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である請求項21に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項24】  $R_1$ が水素原子であり、 $R_2$ が水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である請求項22に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項25】  $R_1$ がアシル基である請求項23に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項26】  $R_1$ がアシル基である請求項24に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項27】  $R_1$ が置換基を有しても良いシンナモイル基からなるアシル基である請求項25に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項28】  $R_1$ が置換基を有しても良いシンナモイル基からなるアシル基である請求項26に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

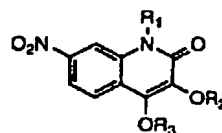
【請求項29】  $R_1$ が4-ヒドロキシ-3-メトキシシンナモイル基、又は、3, 5-ジメトキシ-4-ヒドロキシシンナモイル基である請求項27に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項30】  $R_1$ が4-ヒドロキシ-3-メトキシシンナモイル基、又は、3, 5-ジメトキシ-4-ヒドロキシシンナモイル基である請求項28に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【請求項31】 請求項17~30のいずれか一つに記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩を有効成分とする抗アレルギー剤。

【請求項32】 一般式 (I I)

【化3】



(式中、 $R_1$ は水素原子、又はアルキル基であり、 $R_2$ は水素原子、アシル基、アルキル基、又はアルケニル基であり、 $R_3$ は水素原子、アルキル基、又はアルケニル基である。)で表される7-ニトロキノリノン誘導体。

【請求項33】  $R_1$ が水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基である請求項32に記載の7-ニトロキノリノン誘導体。

【請求項34】  $R_1$ と $R_2$ が同一もしくは異なって、水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である請求項32に記載の7-ニトロキノリノン誘導体。

【請求項35】  $R_1$ が水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基であり、 $R_2$ と $R_3$ が同一もしくは異なって、水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である請求項32~34のいずれか一つに記載の7-ニトロキノリノン誘導体。

【請求項36】  $R_1$ が炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基であり、 $R_2$ が水素原子である請求項35に記

載の7-ニトロキノリノン誘導体。

【請求項37】  $R_1$  がアシル基であり、 $R_2$  が水素原子、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である請求項35に記載の7-ニトロキノリノン誘導体。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】 本発明は、アレルギー疾患の治療剤又は緩剤として有用な新規な7-アミノキノリノン誘導体及びその生理学的に許容される塩、及び該7-アミノキノリノン誘導体の合成中間体である7-ニトロキノリノン誘導体、及び該7-アミノキノリノン誘導体及びその生理学的に許容される塩を有効成分として含有する抗アレルギー剤である。

【0002】

【従来の技術】 本発明の如き3位及び4位に直接酸素原子が結合したキノリノン誘導体に関しては、以下に記載する文献にいくつかの化合物が開示されている。先ず、キノリンの含酸素環の3位及び4位に置換基を有し、芳香族環に置換基を有しないキノリノン化合物としては、モナーシェフテ フォー ケミー、98(1)、100-104ページ、1967年(Monatsh. Chem., 98(1)、100-104、1967)に、3-メトキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、3-エトキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、3,4-ジメトキシ-2(1H)-キノリノンの赤外吸収スペクトルデータの記載がある。

【0003】 モナーシェフテ フォー ケミー、99(6)、2157-2166ページ、1968年(Monatsh. Chem., 99(6)、2157-2166、1968)には、3,4-ジヒドロキシ-2(1H)-キノリノン及び3,4-ジヒドロキシ-1-フェニル-2(1H)-キノリノンの製造法の記載がある。

【0004】 またリービヒ アナーレン ケミー 9、1545-1551ページ、1973年(Liebigs Ann. Chem., 9, 1545-1551、1973)には、3,4-ジヒドロキシ-1-フェニル-2(1H)-キノリノン及び3,4-ジアセトキシ-1-フェニル-2(1H)-キノリノンの製造法の記載がある。

【0005】 更に、ケミッシュ ベリヒテ 106、1537-1548ページ、1973年(Chem. Ber., 106、1537-1548、1973)には、3,4-ジヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノンの製造法の記載があり、ツワイトシュリフト

(Z. Naturforsch., B; Anorg. Chem., Org. Chem., 33B(4)429-432、1978)にも、3,4-ジヒドロキシ-1-フェニル-2(1H)-キノリノンの製造法の記載があ

る。

【0006】 モナーシェフテ フォー ケミー、115(2)、231-242ページ、1984年(Monatsh. Chem., 115(2)、231-242、1984)には、3,4-ジヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、3-メトキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、3-エトキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、3-プロポキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、3-トリフロロアセトキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、3-メトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノンの製造法の記載がある。

【0007】 またフォスフォラス アンド サルファー 21(1)、47-52ページ、1984年(Phosphorus and sulfur, 21(1)、47-52、1984)には、3,4-ジヒドロキシ-2(1H)-キノリノン3-ジメチルフォスフェート、3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリノン、3-ジメチルフォスフェート、3,4-ジヒドロキシ-2(1H)-キノリノン3-ジエチルフォスフェート、3,4-ジヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、3-ジイソプロピルフォスフェート及びこれら化合物のN-メチル体の記載がある。

【0008】 フェブス レターズ、246(1-2)、113-116ページ、1989年(FEBS Lett., 246(1-2)、113-116、1989)には、3,4-ジヒドロキシ-2(1H)-キノリノンの製造法の記載がある。

【0009】 またファイトケミストリー、28(5)、1517-1519ページ、1989年(Phytochemistry, 28(5)、1517-1519、1989)には、クラウセナ アニサタ(Clausena anisata)からの抽出物として、3,4-ジメトキシ-2(1H)-キノリノン及び3,4-ジメトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノンの記載がある。

【0010】 キノリノンの芳香族環に置換基を有するものとしては、インデアン ジャーナル オブ ケミストリー, Sect. B, 15B(5)、440-444ページ、1977年(Indian J. Chem., Sect. B, 15B(5)、440-444、1977)に、クロロキロン スイエテニア DC(Chloroxylon swietenia DC)の樹皮より得られた化合物として、3,4-ジメトキシ-2(1H)-キノリノン、8-メトキシ-3-メトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン及びそのメチルエーテル体である8-メトキシ-3,4-ジ

メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノンの記載がある。

【0011】また、インデアン ジャーナル オブ ケミストリー, Sect. B, 22B (12)、1254-1256ページ、1983年 (Indian J. Chem., Sect. B, 22B (12)、1254-1256、1983) には、8-メトキシ-3-メトキシ-4-ヒドロキシ-2 (1H) -キノリノン、8-メトキシ-3, 4-ジメトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノンの製造法の記載がある。

【0012】また、ジャーナル オブ ヘテロサイクリック ケミストリー 22、1087-1088ページ、1985年 (J. Heterocyclic Chem., 22, 1985) には、3-メトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、8-メトキシ-3-メトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノンの製造法の記載があり、

【0013】ジャーナル オブ ナチュラル プロダクツ、58 (4)、574-576ページ、1995年 (Journal of Natural Products, 58 (4), 574-576, 1995) には、エリオステモン ガルドネリ (Eriostemon gardneri) から得られた成分として、8-メトキシ-3, 4-ジヒドロキシ-2 (1H) -キノリノンの記載がある。しかしながら、上述のように、キノリノン誘導体の芳香族環の置換基としては、メトキシ基が知られているのみである。

【0014】また、米国特許5378694号公報 (WO 92/04328、特公平6-502845号公報) には、3位置換基としてカルボニル基、4位置換基として、水酸基あるいはアルコキシ基の導入されたキノリノン誘導体及び該化合物の抗ウイルス作用及び抗高血圧活性についての記載がある。

【0015】また米国特許5412104号公報 (WO 92/04327、特公平7-110853号公報) には、3位置換基としてカルボニル基を有する置換基、4位置換基として、アルコキシ基、カルボニルオキシ基、アミノ基の置換したキノリノン誘導体及び該化合物の抗ウイルス作用について記載があり、欧州特許0459561A2号公報には、3位置換基として、カルボニル基を含む置換基、4位は互変異性体である4-ケトン体として2, 4-ジオキソテトラヒドロキノリン誘導体についての記載がある。

【0016】欧州特許0481676A1号公報には、3位置換基として、置換基を有する芳香族基、4位置換基として、水酸基を有するキノリノン誘導体について記述があり、米国特許4124587号公報には、3位置換基として、スルフィニル基、4位置換基として、水酸基を有するキノリノン誘導体について記述があり、米国特許4127574号公報には、3位置換基として、ス

ルホニル基、4位置換基として、水酸基を有するキノリノン誘導体について記述がある。

【0017】欧州特許685466A1号公報には、3位置換基として、スルフィド基、4位置換基として、水酸基を有するキノリノン誘導体について記述があり、WO 96/04288には、5, 7-ジメチル-4-ヒドロキシ-2 (1H) -キノリノン、5, 7-ジクロロ-4-ヒドロキシ-2 (1H) -キノリノンの記載がある。

10 【0018】更に、米国特許5179107号公報及び米国特許5190956号公報には芳香族環に置換基を有し、3位及び4位の炭素に直接酸素が結合した、極めて広い範囲のキノリノン誘導体が概念的に記載されている。しかしながら、本発明の如き7位に置換基、更に具体的にはアミノ基もしくはニトロ基を有するキノリノン誘導体は具体的には全く開示されていない。

【0019】これらの米国特許に具体的に開示されたキノリノン誘導体は、3位と4位に存在する置換基が同一の置換基である特徴を有し、且つ、抗ウイルス活性を有することが開示されている。しかしながら、本発明の7位にアミノ基を有するキノリノン誘導体、及び7位にアミノ基を有するキノリノン誘導体が抗アレルギー活性を有することについては何ら記載されていない。

【0020】一方、従来、即時型アレルギー (所謂、I型アレルギー) のみに有効性を示す抗アレルギー剤は多数知られていたが、遅延型アレルギーに有効な抗アレルギー剤の報告は殆ど無い。しかしながら、各種のアレルギー性疾患の内、難治性のアレルギー性疾患には遅延型アレルギーが関与しており、臨床においては遅延型アレルギーに有効であるステロイド剤が使用されている。

【0021】ステロイド剤は高い治療効果が得られるものの、消化性潰瘍、易感染性、精神変調、ステロイド性糖尿、多毛、ムーンフェイス、骨が脆くなる骨粗しょう症、及び肥満等の重篤な副作用がある。この為、ステロイド剤の臨床での使用は極めて制限され、且つその使用に医師の細心の注意を必要とする。

【0022】この為、ステロイド剤は主として軽度なアレルギー性皮膚疾患等には、外用薬剤として多く使用されているが、全身性アレルギー性疾患、特に遅延型アレルギーに対しては、その有効性は認められながらも、その使用は極めて制限されているのが現状であり、即時型及び遅延型アレルギーの両者に有効であり、且つ副作用の少ない薬剤の開発が囑望されていた。

【0023】本発明の7位の置換基としてアミノ基の誘導体を有するキノリノン誘導体、及びその合成中間体として有用な7-ニトロキノリノン誘導体については、従来知られておらず、また該7-アミノキノリノン誘導体及びその生理学的に許容される塩が、即時型及び遅延型アレルギーの両者に有効であり、且つ副作用が少ない薬剤として有用であるとの知見は全く得られていなかった

た。

【0024】

【発明が解決しようとする課題】本発明が解決しようとする課題は、新規なニトロキノリノン誘導体、該ニトロキノリノン誘導体から合成されるアミノキノリノン誘導体及びその生理学的に許容される塩、更に、該アミノキノリノン誘導体及びその生理学的に許容される塩を有効成分とする、安全性の高い医薬品、特に即時型アレルギー性疾患及び遅延型アレルギー性疾患に対して有効な、極めて優れた抗アレルギー剤を提供することにある。

【0025】

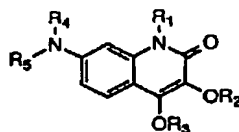
【課題を解決するための手段】本発明者らは、上記の課題を達成する為に、多数の化合物を合成し、その薬効及び安全性を評価した。その結果、芳香族基の置換基として7位にニトロ基を有する7-ニトロキノリノン誘導体の合成に成功、更に該化合物からアミノ基を有する7-アミノキノリノン誘導体の合成に成功し、7-アミノキノリノン誘導体が抗アレルギー剤として極めて有用であることを見出し、本発明を完成させるに至った。

【0026】即ち、本発明は、下記の1. から37. に記載の、

1. 一般式 (I)

【0027】

【化4】



【0028】(式中、R<sub>1</sub>は水素原子、又はアルキル基であり、R<sub>2</sub>とR<sub>3</sub>とは互いに異なり、各々、水素原子、アシル基、アルキル基、又はアルケニル基から選ばれる基であり、R<sub>4</sub>とR<sub>5</sub>は同一もしくは異なって、各々、水素原子、アシル基、アルキル基、アルケニル基、又はアラルキル基から選ばれる基である。)で表される7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0029】2. R<sub>1</sub>が水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基である1. に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0030】3. R<sub>2</sub>とR<sub>3</sub>が各々、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である1. に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0031】4. R<sub>4</sub>とR<sub>5</sub>が同一もしくは異なって、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基で

ある1. に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0032】5. R<sub>1</sub>が水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基であり、R<sub>2</sub>とR<sub>3</sub>が各々、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基であり、R<sub>4</sub>とR<sub>5</sub>が同一もしくは異なって、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である1. から4. のいずれか一つに記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0033】6. R<sub>1</sub>が水素原子であり、R<sub>2</sub>が直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である5. に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0034】7. R<sub>2</sub>がアシル基であり、R<sub>3</sub>が水素原子である5. に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

8. R<sub>2</sub>がアシル基であり、R<sub>3</sub>が直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である5. に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0035】9. R<sub>4</sub>が直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基であり、R<sub>5</sub>が水素原子である5. に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0036】10. R<sub>4</sub>が直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基であり、R<sub>5</sub>がアシル基である5. に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0037】11. R<sub>2</sub>とR<sub>3</sub>が互いに異なる直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である5. に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0038】12. R<sub>4</sub>が水素原子であり、R<sub>5</sub>が水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である6. から11. のいずれか一つに記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0039】13. R<sub>4</sub>がアシル基である12. に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

14.  $R_4$ が置換基を有しても良いシンナモイル基からなるアシル基である13.に記載の7-アミノキノリノン誘導体及びその生理学的に許容される塩。

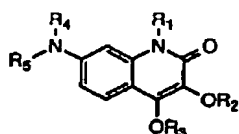
【0040】15.  $R_4$ が4-ヒドロキシ-3-メトキシシンナモイル基、又は、3, 5-ジメトキシ-4-ヒドロキシシンナモイル基である14.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0041】16. 1.から15.のいずれか一つに記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩を有効成分とする抗アレルギー剤。

【0042】17. 一般式(I)

【0043】

【化5】



【0044】(式中、 $R_1$ は水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基であり、 $R_2$ と $R_3$ は同一で、水素原子、アルキル基、又はアルケニル基であり、 $R_4$ と $R_5$ は同一もしくは異なって、水素原子、アシル基、アルキル基、アルケニル基、又はアラルキル基である。)で表される7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0045】18.  $R_2$ と $R_3$ が水素原子、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である17.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0046】19.  $R_4$ と $R_5$ が同一もしくは異なって、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である17.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0047】20.  $R_4$ と $R_5$ が水素原子、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基であり、 $R_4$ と $R_5$ が同一もしくは異なって、水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である17.から19.のいずれか一つに記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0048】21.  $R_2$ と $R_3$ が水素原子である20.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

22.  $R_2$ と $R_3$ が直鎖状もしくは枝分かれした炭素数

1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である20.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0049】23.  $R_4$ が水素原子であり、 $R_5$ が水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である21.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0050】24.  $R_4$ が水素原子であり、 $R_5$ が水素原子、アシル基、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基、又はアラルキル基である22.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0051】25.  $R_4$ がアシル基である23.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

26.  $R_5$ がアシル基である24.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0052】27.  $R_4$ が置換基を有しても良いシンナモイル基からなるアシル基である25.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

28.  $R_4$ が置換基を有しても良いシンナモイル基からなるアシル基である26.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0053】29.  $R_4$ が4-ヒドロキシ-3-メトキシシンナモイル基、又は、3, 5-ジメトキシ-4-ヒドロキシシンナモイル基である27.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

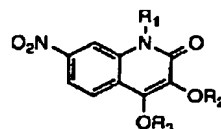
【0054】30.  $R_4$ が4-ヒドロキシ-3-メトキシシンナモイル基、又は、3, 5-ジメトキシ-4-ヒドロキシシンナモイル基である28.に記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩。

【0055】31. 17.から30.のいずれか一つに記載の7-アミノキノリノン誘導体、及びその生理学的に許容される塩を有効成分とする抗アレルギー剤。

【0056】32. 一般式(II)

【0057】

【化6】



【0058】(式中、 $R_1$ は水素原子、又はアルキル基であり、 $R_2$ は水素原子、アシル基、アルキル基、又はアルケニル基であり、 $R_3$ は水素原子、アルキル基、又はアルケニル基である。)で表される7-ニトロキノリン誘導体。

【0059】33.  $R_1$ が水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基である32.に記載の7-ニトロキノリン誘導体。

34.  $R_2$ と $R_3$ が同一もしくは異なって、水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である32.に記載の7-ニトロキノリン誘導体。

【0060】35.  $R_1$ が水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基であり、 $R_2$ と $R_3$ が同一もしくは異なって、水素原子、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である32.から34.に記載の7-ニトロキノリン誘導体。

【0061】36.  $R_1$ が炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基であり、 $R_2$ が水素原子である35.に記載の7-ニトロキノリン誘導体。

37.  $R_1$ がアシル基であり、 $R_2$ が水素原子、直鎖状もしくは枝分かれした炭素数1~10のアルキル基、又は直鎖状もしくは枝分かれした炭素数2~10のアルケニル基である35.に記載の7-ニトロキノリン誘導体。

【0062】で示される、新規なニトロキノリン誘導体、該ニトロキノリン誘導体から合成されるアミノキノリン誘導体、及び該アミノキノリン誘導体を有効成分とする即時型アレルギー及び遅延型アレルギーに有効で、且つ安全性の高い抗アレルギー剤である。

【0063】

【発明の実施の形態】本発明の一般式(I)、及び(I')で示される7-アミノキノリン誘導体及び7-ニトロキノリン誘導体における $R_1$ は水素原子又はアルキル基であり、本発明でのアルキル基は、直鎖状でも枝分かれしたアルキル基でも良い。

【0064】具体的には、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、n-ペンチル基、ヘキシル基、オクチル基、デシル基等が挙げられ、好ましくは炭素数1~10、より好ましくは炭素数1~8のアルキル基が挙げられる。

【0065】また、一般式(I)の $R_2$ と $R_3$ は水素原子、アシル基、アルキル基又はアルケニル基である。アシル基の例としては、例えばホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基等で表されるアルカノイル基、ベンゾイル基等が挙げられる。ベンゾイル基は置換

基を有しても良く、例えば、p-ヒドロキシベンゾイル基、p-メトキシベンゾイル基、2,4-ジヒドロキシベンゾイル基、2,4-ジメトキシベンゾイル基等が挙げられる。好ましくはアルカノイル基であり、特に好ましくはアセチル基である。

【0066】アルキル基の例としては、直鎖状でも枝分かれしたアルキル基でも良く、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、n-ペンチル基、ヘキシル基、オクチル基、デシル基等が挙げられ、好ましくは1~10、より好ましくは炭素数1~8のアルキル基が挙げられる。

【0067】アルケニル基の例としては、直鎖状でも枝分かれしたアルケニル基でも良く、例えばビニル基、プロペニル基、ヘキセニル基、オクテニル基、プレニル基、ゲラニル基等が挙げられ、好ましくは炭素数2~10、より好ましくは炭素数3~8のアルケニル基が挙げられる。

【0068】また、一般式(I)、及び(I')において、 $R_1$ と $R_2$ は同一もしくは異なって、水素原子、アシル基、アルキル基、アルケニル基、又はアラルキル基である。アシル基の例としては、例えば、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基等で表されるアルカノイル基、ベンゾイル基、置換されたベンゾイル基、もしくは置換されていても良いシンナモイル基である。

【0069】置換されたベンゾイル基は、例えば、p-ヒドロキシベンゾイル基、p-メトキシベンゾイル基、2,4-ジヒドロキシベンゾイル基、2,4-ジメトキシベンゾイル基等であり、置換されていても良いシンナモイル基は、例えば、シンナモイル基、2-ヒドロキシシンナモイル基、3-ヒドロキシシンナモイル基、4-ヒドロキシシンナモイル基、3,4-ジヒドロキシシンナモイル基、4-ヒドロキシ-3-メトキシシンナモイル基、3-ヒドロキシ-4-メトキシシンナモイル基、3,5-ジメトキシ-4-ヒドロキシシンナモイル基等が挙げられる。好ましくは置換されていてもよいシンナモイル基が挙げられる。

【0070】一般式(I)、及び(I')の $R_2$ と $R_3$ のアルキル基としては、直鎖状でも枝分かれしたアルキル基でも良く、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、n-ペンチル基、ヘキシル基、オクチル基、デシル基等が挙げられ、好ましくは炭素数1~10のアルキル基が挙げられ、より好ましくは炭素数1~8のアルキル基が挙げられる。

【0071】アルケニル基としては、直鎖状でも枝分かれしたアルケニル基でも良く、例えばビニル基、プロペニル基、ヘキセニル基、オクテニル基、プレニル基、ゲラニル基等が挙げられ、好ましくは炭素数2~10のアルケニル基、より好ましくは炭素数3~8のアルケニル



基が挙げられる。

【0072】アラルキル基の例としては、ベンジル基、置換されたベンジル基（例えば、p-メトキシベンジル基、p-ヒドロキシベンジル基等）のアラルキル基が挙げられる。本発明は、一般式（I）、及び（II）で示される7-アミノキノリノン誘導体のR<sub>1</sub>とR<sub>2</sub>の置換基が同一の置換基である7-アミノキノリノン誘導体も、上述の群から選択された置換基の異なる組み合わせからなる7-アミノキノリノン誘導体をも含む。

【0073】また、本発明の7-アミノキノリノン誘導体の重要な原料物質である、一般式（II）で示される7-ニトロキノリノン誘導体において、R<sub>1</sub>は水素原子、アシル基、アルキル基又はアルケニル基である。アシル基としては、例えばホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基等で表されるアルカノイル基、ベンゾイル基等が挙げられ、ベンゾイル基は置換基を有しても良く、例えば、p-ヒドロキシベンゾイル基、p-メトキシベンゾイル基、2, 4-ジヒドロキシベンゾイル基、2, 4-ジメトキシベンゾイル基等が挙げられる。好ましくはアルカノイル基であり、特に好ましくはアセチル基である。

【0074】アルキル基としては、直鎖状でも枝分かれしたアルキル基でも良く、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、n-ペンチル基、ヘキシル基、オクチル基、デシル基等が挙げられ、好ましくは1~10、より好ましくは炭素数1~8のアルキル基が挙げられる。

【0075】アルケニル基の例としては、直鎖状でも枝分かれしたアルケニル基でも良く、例えばビニル基、プロペニル基、ヘキセニル基、オクテニル基、プレニル基、ゲラニル基等が挙げられ、好ましくは炭素数2~10、より好ましくは炭素数3~8のアルケニル基が挙げられる。

【0076】また、一般式（II）において、R<sub>2</sub>は水素原子、アルキル基又はアルケニル基である。アルキル基の例としては、直鎖状でも枝分かれしたアルキル基でも良く、例えば、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、s-ブチル基、n-ペンチル基、ヘキシル基、オクチル基、デシル基等が挙げられ、好ましくは1~10、より好ましくは炭素数1~8のアルキル基が挙げられる。

【0077】アルケニル基の例としては、直鎖状でも枝分かれしたアルケニル基でも良く、例えばビニル基、プロペニル基、ヘキセニル基、オクテニル基、プレニル基、ゲラニル基等が挙げられ、好ましくは炭素数2~10、より好ましくは炭素数3~8のアルケニル基が挙げられる。

【0078】本発明の一般式（I）で示される7-アミノキノリノン誘導体の具体例としては、下記の化合物が挙げられる。7-アミノ-3-アセトキシ-4-メトキ

シ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-ブトキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-2（1H）-キノリノン、

【0079】7-アミノ-3-アセトキシ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-ゲラニルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-ホルミルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-2（1H）-キノリノン、

【0080】7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ゲラニルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-アセトキシ-3-メトキシ-2（1H）-キノリノン、

【0081】7-アミノ-4-アセトキシ-3-ブトキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-アセトキシ-3-ヘキシルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-アセトキシ-3-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-アセトキシ-3-ゲラニルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-ベンゾイルオキシ-3-メトキシ-2（1H）-キノリノン、

【0082】7-アミノ-4-ベンゾイルオキシ-3-ブトキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-ベンゾイルオキシ-3-ヘキシルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-ベンゾイルオキシ-3-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-ベンゾイルオキシ-3-ゲラニルオキシ-2（1H）-キノリノン、

【0083】7-アミノ-3, 4-ジメトキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-3-メトキシ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-2（1H）-キノリノン、

【0084】7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-イソプロポキシ-2（1H）-キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-2（1H）-キノリノン、7-ア

17

ミノ-3-イソプロポキシ-4-(3-メチル-2-ブ  
テニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、

【0085】7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-イ  
ソプロポキシ-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-  
4-ヒドロキシ-3-イソプロポキシ-2(1H)-キノ  
リノン、7-アミノ-3-ブトキシ-4-メトキシ-  
2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3, 4-ジブト  
キシ-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-ブト  
キシ-4-ヘキシルオキシ-2(1H)-キノリノン、  
7-アミノ-3-ブトキシ-4-(3-メチル-2-ブ  
テニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、

【0086】7-アミノ-3-ブトキシ-4-ゲラニル  
オキシ-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-ブ  
トキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、7-  
アミノ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-2(1  
H)-キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-ヘ  
キシルオキシ-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-  
3, 4-ジヘキシルオキシ-2(1H)-キノリノン、

【0087】7-アミノ-3-ヘキシルオキシ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-2(1H)-キノ  
リノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキ  
シルオキシ-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-  
ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノ  
リノン、7-アミノ-4-メトキシ-3-(2-メチル  
ペンチルオキシ)-2(1H)-キノリノン、7-アミ  
ノ-4-ブトキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-  
2(1H)-キノリノン、

【0088】7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-  
(2-メチルペンチルオキシ)-2(1H)-キノリ  
ノン、7-アミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキ  
シ)-3-(2-メチルペンチルオキシ)-2(1H)-  
キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-  
(2-メチルペンチルオキシ)-2(1H)-キノリ  
ノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-(2-メチル  
ペンチルオキシ)-2(1H)-キノリノン、

【0089】7-アミノ-4-メトキシ-3-オクチル  
オキシ-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ブ  
トキシ-3-オクチルオキシ-2(1H)-キノリ  
ノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチル  
オキシ-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-(3-  
メチル-2-ブテニルオキシ)-3-オクチルオキシ  
-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニル  
オキシ-3-オクチルオキシ-2(1H)-キノリ  
ノン、

【0090】7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-オクチ  
ルオキシ-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-  
メトキシ-3-(2-プロベニルオキシ)-2(1H)-  
キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-(2-  
プロベニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、7-ア  
ミノ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-プロベニルオキ

18

シ)-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-(3-  
メチル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-プロベニ  
ルオキシ)-2(1H)-キノリノン、

【0091】7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-  
(2-プロベニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、  
7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-(2-プロベニル  
オキシ)-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-ゲ  
ラニルオキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリ  
ノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ  
-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニル  
オキシ-4-ヘキシルオキシ-2(1H)-キノリ  
ノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-(3-メチル  
-2-ブテニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、

【0092】7-アミノ-3, 4-ジゲラニルオキシ  
-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニル  
オキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、7-  
アミノ-3, 4-ジヒドロキシ-2(1H)-キノリ  
ノン、7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2  
(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-  
ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、

【0093】7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒ  
ドロキシ-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-  
ヒドロキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)  
-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニル  
オキシ-3-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、7-  
アミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル  
-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-アセトキ  
シ-4-エトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリ  
ノン、

【0094】7-アミノ-3-アセトキシ-4-ブトキ  
シ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ  
-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル  
-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ  
-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチ  
ル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-アセト  
キシ-4-ゲラニルオキシ-1-メチル-2(1H)-  
キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-ヒド  
ロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0095】7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-メ  
トキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ア  
ミノ-4-ブトキシ-3-ホルミルオキシ-1-メチル  
-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-ホルミル  
オキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-  
キノリノン、7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2  
(1H)-キノリノン、

【0096】7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ゲ  
ラニルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、  
7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-1  
-メチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-

アセトキシ-3-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-アセトキシ-3-ブトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-アセトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0097】7-アミノ-4-アセトキシ-3-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-アセトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ベンゾイルオキシ-3-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ベンゾイルオキシ-3-ブトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0098】7-アミノ-4-ベンゾイルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ベンゾイルオキシ-3-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ベンゾイルオキシ-3-ゲラニルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3, 4-ジメトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0099】7-アミノ-4-ブトキシ-3-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-メトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0100】7-アミノ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-イソプロポキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0101】7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ブトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3, 4-ジブトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ブトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0102】7-アミノ-3-ブトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ブトキシ-4-ゲラニ

ルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ブトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0103】7-アミノ-3, 4-ジヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ヘキシルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0104】7-アミノ-4-メトキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0105】7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-メトキシ-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0106】7-アミノ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0107】7-アミノ-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-メトキシ-3-(2-プロベニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-(2-プロベニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-プロベニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-プロベニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0108】7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-プロベニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-(2-

21

プロベニルオキシ) - 1-メチル-2 (1H) -キノリ  
 ノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ  
 -1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-  
 4-プトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-メチル-2  
 (1H) -キノリノン、

【0109】7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘ  
 キシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、  
 7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4- (3-メチル-  
 2-プテニルオキシ) -1-メチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、7-アミノ-3, 4-ジゲラニルオキシ-1-  
 メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ゲ  
 ラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1  
 H) -キノリノン、

【0110】7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキ  
 シ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ  
 -4-プトキシ-3-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1  
 H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-  
 3-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノ  
 ン、7-アミノ-3-ヒドロキシ-4- (3-メチル-  
 2-プテニルオキシ) -1-メチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロ  
 キシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0111】7-アミノ-3, 4-ジヒドロキシ-1-  
 メチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ア  
 セトキシ-4-メトキシ-1-エチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-エトキシ  
 -1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-  
 3-アセトキシ-4-プトキシ-1-エチル-2 (1  
 H) -キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-  
 ヘキシルオキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノ  
 ン、

【0112】7-アミノ-3-アセトキシ-4- (3-  
 メチル-2-プテニルオキシ) -1-エチル-2 (1  
 H) -キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-  
 ゲラニルオキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノ  
 ン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1  
 -エチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-  
 ホルミルオキシ-4-メトキシ-1-エチル-2 (1  
 H) -キノリノン、

【0113】7-アミノ-4-プトキシ-3-ホルミル  
 オキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ア  
 ミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-  
 エチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ホ  
 ルミルオキシ-4- (3-メチル-2-プテニルオキ  
 シ) -1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0114】7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ゲ  
 ラニルオキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、  
 7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-1  
 -エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0115】7-アミノ-3, 4-ジメトキシ-1-エ

22

チル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-プト  
 キシ-3-メトキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリ  
 ノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ  
 -1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-  
 3-メトキシ-4- (3-メチル-2-プテニルオキ  
 シ) -1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0116】7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-メ  
 トキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ア  
 ミノ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-1-エチル-2  
 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-イソプロボキ  
 シ-4-メトキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノ  
 ン、7-アミノ-4-プトキシ-3-イソプロボキシ-  
 1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0117】7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-イ  
 ソプロボキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、  
 7-アミノ-3-イソプロボキシ-4- (3-メチル-  
 2-プテニルオキシ) -1-エチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプ  
 ロボキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0118】7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-イソプ  
 ロボキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-  
 アミノ-3-プトキシ-4-メトキシ-1-エチル-2  
 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3, 4-ジプトキ  
 シ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ  
 -3-プトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-エチル-2  
 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-プトキシ-4  
 - (3-メチル-2-プテニルオキシ) -1-エチル-  
 2 (1H) -キノリノン、

【0119】7-アミノ-3-プトキシ-4-ゲラニル  
 オキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ア  
 ミノ-3-プトキシ-4-ヒドロキシ-1-エチル-2  
 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ヘキシルオキ  
 シ-4-メトキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノ  
 ン、7-アミノ-4-プトキシ-3-ヘキシルオキシ-  
 1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0120】7-アミノ-3, 4-ジヘキシルオキシ-  
 1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3  
 -ヘキシルオキシ-4- (3-メチル-2-プテニルオ  
 キシ) -1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ア  
 ミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-  
 エチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ヘ  
 キシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-エチル-2 (1  
 H) -キノリノン、

【0121】7-アミノ-4-メトキシ-3- (2-メ  
 チルベンチルオキシ) -1-エチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、7-アミノ-4-プトキシ-3- (2-メチル  
 ベンチルオキシ) -1-エチル-2 (1H) -キノリノ  
 ン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-メチ  
 ルベンチルオキシ) -1-エチル-2 (1H) -キノリ  
 ノン、7-アミノ-4- (3-メチル-2-プテニルオ

キシ) - 3 - (2-メチルベンチルオキシ) - 1-エチル-2 (1H) - キノリノン、

【0122】 7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ) - 1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ) - 1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-メトキシ-3-オクチルオキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、

【0123】 7-アミノ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ) - 3-オクチルオキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-オクチルオキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、

【0124】 7-アミノ-4-メトキシ-3-(2-プロペニルオキシ) - 1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-(2-プロペニルオキシ) - 1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-プロペニルオキシ) - 1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ) - 3-(2-プロペニルオキシ) - 1-エチル-2 (1H) - キノリノン、

【0125】 7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-プロペニルオキシ) - 1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-(2-プロペニルオキシ) - 1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、

【0126】 7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ) - 1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3, 4-ジゲラニルオキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、

【0127】 7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ) - 1-エチル-2 (1H) - キノ

リノン、

【0128】 7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3, 4-ジヒドロキシ-1-エチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-プロポキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、

【0129】 7-アミノ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-デシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-エトキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-ブトキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、

【0130】 7-アミノ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ) - 1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、

【0131】 7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-ホルミルオキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ) - 1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、

【0132】 7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3, 4-ジメトキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、

【0133】 7-アミノ-3-メトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ) - 1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) - キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-イソプロポキシ

ー1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0134】7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-イソプロポキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロポキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-イソプロポキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0135】7-アミノ-3-ブトキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3, 4-ジブトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ブトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ブトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ブトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0136】7-アミノ-3-ブトキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3, 4-ジヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ヘキシルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0137】7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-メトキシ-3- (2-メチルベンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3- (2-メチルベンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-メチルベンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0138】7-アミノ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3- (2-メチルベンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-メチルベンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3- (2-メチルベンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-メトキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0139】7-アミノ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-

(3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0140】7-アミノ-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-メトキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0141】7-アミノ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0142】7-アミノ-4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3, 4-ゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0143】7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ヒドロキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0144】7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3, 4-ジヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-エトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-ブトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0145】7-アミノ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4- (3-メチル-2-ブ

テニルオキシ) - 1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、  
7-アミノ-3-アセトキシ-4-ゲラニルオキシ  
-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ  
-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2  
(1H) -キノリノン、

【0146】7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-メ  
トキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-  
アミノ-4-プトキシ-3-ホルミルオキシ-1-ヘキ  
シル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ホル  
ミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2  
(1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ホルミルオキ  
シ-4- (3-メチル-2-プテニルオキシ) -1-ヘ  
キシル-2 (1H) -キノリノン、

【0147】7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ゲ  
ラニルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノ  
ン、7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ  
-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ  
-3, 4-ジメトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-4-プトキシ-3-メトキシ-  
1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-  
3-メトキシ-4- (3-メチル-2-プテニルオキ  
シ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0148】7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-メ  
トキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-  
アミノ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-1-ヘキシル  
-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-イソプロ  
ボキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-4-プトキシ-3-イソプロボ  
キシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ア  
ミノ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロボキシ-1-  
ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0149】7-アミノ-3-イソプロボキシ-4-  
(3-メチル-2-プテニルオキシ) -1-ヘキシル-  
2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオ  
キシ-3-イソプロボキシ-1-ヘキシル-2 (1H)  
-キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-イソ  
プロボキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0150】7-アミノ-3-プトキシ-4-メトキシ  
-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ  
-3, 4-ジプトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-3-プトキシ-4-ヘキシルオ  
キシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ア  
ミノ-3-プトキシ-4- (3-メチル-2-プテニル  
オキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0151】7-アミノ-3-プトキシ-4-ゲラニル  
オキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-  
アミノ-3-プトキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル  
-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ヘキシル  
オキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-4-プトキシ-3-ヘキシルオ  
キシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

キシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0152】7-アミノ-3, 4-ジヘキシルオキシ-  
1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-  
3-ヘキシルオキシ-4- (3-メチル-2-プテニル  
オキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-  
アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-  
1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-  
3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-  
2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-メトキシ-  
3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ヘキシル-2  
(1H) -キノリノン、

【0153】7-アミノ-4-プトキシ-3- (2-メ  
チルペンチルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-  
メチルペンチルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H)  
-キノリノン、7-アミノ-4- (3-メチル-2-プ  
テニルオキシ) -3- (2-メチルペンチルオキシ) -  
1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0154】7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-  
(2-メチルペンチルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1  
H) -キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-  
(2-メチルペンチルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1  
H) -キノリノン、7-アミノ-4-メトキシ-3-オ  
クチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノ  
ン、7-アミノ-4-プトキシ-3-オクチルオキシ-  
1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-  
4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシ  
ル-2 (1H) -キノリノン、

【0155】7-アミノ-4- (3-メチル-2-プテ  
ニルオキシ) -3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2  
(1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキ  
シ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-オクチ  
ルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-  
アミノ-4-メトキシ-3- (2-プロベニルオキ  
シ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0156】7-アミノ-4-プトキシ-3- (2-プ  
ロベニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリ  
ノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-プ  
ロベニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリ  
ノン、7-アミノ-4- (3-メチル-2-プテニルオ  
キシ) -3- (2-プロベニルオキシ) -1-ヘキシル  
-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニル  
オキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-ヘキシル  
-2 (1H) -キノリノン、

【0157】7-アミノ-4-ヒドロキシ-3- (2-  
プロベニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキ  
シ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミ  
ノ-4-プトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-ヘキシル

ー2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニル  
オキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1  
H) -キノリノン、

【0158】7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ヘキシル-  
2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニルオ  
キシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-3, 4-ジゲラニルオキシ-1  
-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3  
-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1  
H) -キノリノン、7-アミノ-4-プトキシ-3-ヒ  
ドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0159】7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒ  
ドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7  
-アミノ-3-ヒドロキシ-4- (3-メチル-2-ブ  
テニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノ  
ン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ  
-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ  
-3, 4-ジヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -  
キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4-メトキ  
シ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0160】7-アミノ-3-アセトキシ-4-エトキ  
シ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミ  
ノ-3-アセトキシ-4-プトキシ-1-オクチル-2  
(1H) -キノリノン、7-アミノ-3-アセトキシ-  
4-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-3-アセトキシ-4- (3-メチ  
ル-2-ブテニルオキシ)-1-オクチル-2 (1H)  
-キノリノン、

【0161】7-アミノ-3-アセトキシ-4-ゲラニ  
ルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7  
-アミノ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-オク  
チル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ホル  
ミルオキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H)  
-キノリノン、7-アミノ-4-プトキシ-3-ホルミ  
ルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7  
-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ  
-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0162】7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-オクチル-  
2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-ホルミルオ  
キシ-4-ゲラニルオキシ-1-オクチル-2 (1H)  
-キノリノン、7-アミノ-3-ホルミルオキシ-4-  
ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、  
7-アミノ-3, 4-ジメトキシ-1-オクチル-2  
(1H) -キノリノン、

【0163】7-アミノ-4-プトキシ-3-メトキシ  
-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ  
-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-1-オクチル-  
2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-メトキシ-

4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-オクチ  
ル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニ  
ルオキシ-3-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -  
キノリノン、

【0164】7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-メトキ  
シ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミ  
ノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-オクチ  
ル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-3-イソブ  
ロボキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -  
キノリノン、7-アミノ-4-プトキシ-3-イソブ  
ロボキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-  
アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-イソブロボキシ-1  
-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0165】7-アミノ-3-イソブロボキシ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-オクチル-  
2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオ  
キシ-3-イソブロボキシ-1-オクチル-2 (1H)  
-キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-イソ  
ブロボキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0166】7-アミノ-3-プトキシ-4-メトキシ  
-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ  
-3, 4-ジプトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-3-プトキシ-4-ヘキシルオ  
キシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ア  
ミノ-3-プトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニル  
オキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7  
-アミノ-3-プトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-オ  
クチル-2 (1H) -キノリノン、

【0167】7-アミノ-3-プトキシ-4-ヒドロキ  
シ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミ  
ノ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-オクチル  
-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-プトキシ  
-3-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-3, 4-ジヘキシルオキシ-1  
-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0168】7-アミノ-3-ヘキシルオキシ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-オクチル-  
2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオ  
キシ-3-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H)  
-キノリノン、7-アミノ-3-ヘキシルオキシ-4-  
ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、  
7-アミノ-4-メトキシ-3- (2-メチルベンチル  
オキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0169】7-アミノ-4-プトキシ-3- (2-メ  
チルベンチルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-  
メチルベンチルオキシ)-1-オクチル-2 (1H)  
-キノリノン、7-アミノ-4- (3-メチル-2-ブ  
テニルオキシ)-3- (2-メチルベンチルオキシ)-  
1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-アミノ-

10

20

30

40

50



4-ゲラニルオキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、

【0170】7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-メトキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、

【0171】7-アミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-メトキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、

【0172】7-アミノ-4-ブトキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、

【0173】7-アミノ-4-ヒドロキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、

【0174】7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3,4-ジゲラニルオキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、

【0175】7-アミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-アミノ

-3,4-ジヒドロキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリノン、

【0176】7-メチルアミノ-3-アセトキシ-4-ブトキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-アセトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-アセトキシ-4-ゲラニルオキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、

【0177】7-メチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-4-ブトキシ-3-ホルミルオキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ゲラニルオキシ-2(1H)-キノリノン、

【0178】7-メチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3,4-ジメトキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-4-ブトキシ-3-メトキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-メトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、

【0179】7-メチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-(2-プロペニルオキシ)-4-ヒドロキシ-1-エチル-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-4-ブトキシ-3-イソプロポキシ-2(1H)-キノリノン、

【0180】7-メチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-イソプロポキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロポキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-イソプロポキシ-2(1H)-キノリノン、

【0181】7-メチルアミノ-3-ブトキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-メチルアミノ-3-ヒドロキシ

10

20

30

40

50

33

ー4-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-メチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-メチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-ブレンニルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0182】7-メチルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-メチルアミノ-4-ヒドロキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-メチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-ブレンニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-メチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-ブレンニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-メチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-ブレンニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0183】7-メチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-ブレンニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-3, 4-ジブトキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-3-ブトキシ-4-ヘキシルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-3-ブトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-3-ブトキシ-4-ゲラニルオキシ-2 (1H) -キノリノン、

【0184】7-エチルアミノ-3-ブトキシ-4-ヒドロキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-3, 4-ジヘキシルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、

【0185】7-エチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4-メトキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4-ブトキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、

【0186】7-エチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3- (2-メチルペンチルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4-ヒドロキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、

34

【0187】7-エチルアミノ-4-メトキシ-3-オクチルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3-オクチルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-2 (1H) -キノリノン、

【0188】7-エチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-オクチルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4-メトキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4-ブトキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-エチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、

【0189】7-ジメチルアミノ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3- (2-プロベニルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-4-ヒドロキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノン、

【0190】7-ジメチルアミノ-4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘキシルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-3, 4-ジゲラニルオキシ-2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-2 (1H) -キノリノン、

【0191】7-ジメチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ヒドロキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-2 (1H) -キノリノン、

【0192】7-ジメチルアミノ-3, 4-ジヒドロキシ-2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-アセトキシ-4-ブトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0193】7-ジメチルアミノ-3-アセトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-アセトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0194】7-ジメチルアミノ-4-プトキシ-3-ホルミルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ゲラニルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0195】7-ジメチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-3,4-ジメトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-4-プトキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0196】7-ジメチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2(1H)-キノリノン、7-ジメチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリノン、

【0197】7-ブチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-メトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0198】7-ブチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

ノリノン、

【0199】7-ブチルアミノ-4-プトキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-イソプロポキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0200】7-ブチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-プトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3,4-ジプトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-プトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0201】7-ブチルアミノ-3-プトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-プトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-プトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-4-プトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0202】7-ブチルアミノ-3,4-ジヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0203】7-ブチルアミノ-4-メトキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-4-プトキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0204】7-ブチルアミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ブチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ヘキシルアミノ-3-メトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-(2-プロペニルアミノ)-4-ヒドロキシ-3-オクチル-1-

10

20

30

40

50

37

メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0205】 7-ブレンリアミノ-4-ヒドロキシ-3-  
 -オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノ  
 ン、7-オクチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-メトキ  
 シ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-オクチ  
 ルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-メチル  
 -2 (1H) -キノリノン、7-オクチルアミノ-4-  
 メトキシ-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1  
 H) -キノリノン、

【0206】 7-オクチルアミノ-4-ブトキシ-3- 10  
 オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノ  
 ン、7-オクチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-オ  
 クチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、  
 7-オクチルアミノ-4- (3-メチル-2-ブテニル  
 オキシ) -3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1  
 H) -キノリノン、7-オクチルアミノ-4-ゲラニル  
 オキシ-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H)  
 -キノリノン、

【0207】 7-オクチルアミノ-4-ヒドロキシ-3  
 -オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノ 20  
 ン、7-オクチルアミノ-4-メトキシ-3- (2-プ  
 ロベニルオキシ) -1-メチル-2 (1H) -キノリノ  
 ン、7-オクチルアミノ-4-ブトキシ-3- (2-プ  
 ロベニルオキシ) -1-メチル-2 (1H) -キノリノ  
 ン、7-オクチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-  
 (2-プロベニルオキシ) -1-メチル-2 (1H) -  
 キノリノン、

【0208】 7-オクチルアミノ-4- (3-メチル-  
 2-ブテニルオキシ) -3- (2-プロベニルオキシ)  
 -1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-オクチル 30  
 アミノ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-プロベニルオ  
 キシ) -1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-オ  
 クチルアミノ-4-ヒドロキシ-3- (2-プロベニル  
 オキシ) -1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-  
 オクチルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ-  
 1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0209】 7-オクチルアミノ-4-ブトキシ-3-  
 ゲラニルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノ  
 ン、7-オクチルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘ  
 キシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、 40  
 7-オクチルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4- (3-  
 メチル-2-ブテニルオキシ) -1-メチル-2 (1  
 H) -キノリノン、7-オクチルアミノ-3-ゲラニル  
 オキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、

【0210】 7-オクチルアミノ-3-ヒドロキシ-4  
 -メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7  
 -オクチルアミノ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1  
 -メチル-2 (1H) -キノリノン、7-オクチルアミ  
 ノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-メチル 50

38

-2 (1H) -キノリノン、7-オクチルアミノ-3-  
 ヒドロキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ)  
 -1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-オクチル  
 アミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1-メ  
 チル-2 (1H) -キノリノン、

【0211】 7-オクチルアミノ-3, 4-ジヒドロキ  
 シ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-オクチ  
 ルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-ブチル  
 -2 (1H) -キノリノン、7- (2-プロベニルアミ  
 ノ) -4-ヒドロキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチ  
 ル-2 (1H) -キノリノン、

【0212】 7- (2-プロベニルアミノ) -3-アセ  
 トキシ-4-ブトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、7- (2-プロベニルアミノ) -3-アセトキ  
 シ-4-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、7- (2-プロベニルアミノ) -3-アセト  
 キシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-  
 ブチル-2 (1H) -キノリノン、7- (2-プロベニ  
 ルアミノ) -3-アセトキシ-4-ゲラニルオキシ-1  
 -ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0213】 7- (2-プロベニルアミノ) -3-アセ  
 トキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、7- (2-プロベニルアミノ) -3-ホルミ  
 ルオキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、7- (2-プロベニルアミノ) -4-ブトキ  
 シ-3-ホルミルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、7- (2-プロベニルアミノ) -3-ホルミ  
 ルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1  
 H) -キノリノン、

【0214】 7- (2-プロベニルアミノ) -3-ホル  
 ミルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ)  
 -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7- (2-プ  
 ロベニルアミノ) -3-ホルミルオキシ-4-ゲラニル  
 オキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-  
 (2-プロベニルアミノ) -3-ホルミルオキシ-4-  
 ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7  
 - (2-プロベニルアミノ) -3, 4-ジメトキシ-1  
 -ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0215】 7- (2-プロベニルアミノ) -4-ブト  
 キシ-3-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリ  
 ノン、7- (2-プロベニルアミノ) -4-ヘキシルオ  
 キシ-3-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリ  
 ノン、7- (2-プロベニルアミノ) -3-メトキシ-  
 4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル  
 -2 (1H) -キノリノン、7- (2-プロベニルアミ  
 ノ) -4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-1-ブチル  
 -2 (1H) -キノリノン、

【0216】 7- (2-プロベニルアミノ) -4-ヒド  
 ロキシ-3-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
 リノン、7- (2-プロベニルアミノ) -3-イソプロ

ボキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-(2-プロベニルアミノ)-4-ブトキシ  
-3-イソプロボキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-(2-プロベニルアミノ)-4-ヘキシル  
オキシ-3-イソプロボキシ-1-ブチル-2 (1H)  
-キノリノン、

【0217】7-(2-プロベニルアミノ)-3-イソ  
プロボキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)  
-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-(2-プ  
ロベニルアミノ)-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロ  
ボキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-  
(2-プロベニルアミノ)-4-ヒドロキシ-3-イソ  
プロボキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0218】7-(2-プロベニルアミノ)-4-ヒド  
ロキシ-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H)  
-キノリノン、7-(2-プロベニルアミノ)-3-ブ  
トキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-(2-プロベニルアミノ)-3-ブトキシ  
-4-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-(2-プロベニルアミノ)-3-ブトキシ  
-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ブチ  
ル-2 (1H) -キノリノン、

【0219】7-ゲラニルアミノ-3-ブトキシ-4-  
ゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノ  
ン、7-ゲラニルアミノ-3-ブトキシ-4-ヒドロキ  
シ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ゲラニ  
ルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-ブ  
チル-2 (1H) -キノリノン、7-ゲラニルアミノ-  
4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2  
(1H) -キノリノン、

【0220】7-ゲラニルアミノ-3, 4-ジヘキシル  
オキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ゲ  
ラニルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-(3-メチル  
-2-ブテニルオキシ)-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-ゲラニルアミノ-4-ゲラニルオキシ-  
3-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリ  
ノン、7-ゲラニルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-  
ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-  
ゲラニルアミノ-4-メトキシ-3-(2-メチルペ  
ンチルオキシ)-1-ブチル-2 (1H) -キノリノ  
ン、

【0221】7-ゲラニルアミノ-4-ブトキシ-3-  
(2-メチルペンチルオキシ)-1-ブチル-2 (1  
H) -キノリノン、7-ゲラニルアミノ-4-ヘキシル  
オキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-ブチ  
ル-2 (1H) -キノリノン、7-ゲラニルアミノ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-メ  
チルペンチルオキシ)-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
リノン、

【0222】7-ゲラニルアミノ-4-ゲラニルオキシ

-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-ブチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ゲラニルアミノ-4-ヒド  
ロキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-ブチ  
ル-2 (1H) -キノリノン、7-ゲラニルアミノ-4-  
メトキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1  
H) -キノリノン、7-ゲラニルアミノ-4-ブトキシ  
-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
リノン、

【0223】7-ゲラニルアミノ-4-ヘキシルオキシ  
-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-ゲラニルアミノ-4-(3-メチル-2-  
ブテニルオキシ)-3-オクチルオキシ-1-ブチル-  
2 (1H) -キノリノン、7-ゲラニルアミノ-4-ゲ  
ラニルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ゲラニルアミノ-4-ヒド  
ロキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H)  
-キノリノン、

【0224】7-ゲラニルアミノ-4-メトキシ-3-  
(2-プロベニルオキシ)-1-ブチル-2 (1H) -  
キノリノン、7-ゲラニルアミノ-4-ブトキシ-3-  
(2-プロベニルオキシ)-1-ブチル-2 (1H) -  
キノリノン、7-ゲラニルアミノ-4-ヘキシルオキシ  
-3-(2-プロベニルオキシ)-1-ブチル-2 (1  
H) -キノリノン、7-ゲラニルアミノ-4-(3-メ  
チル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-プロベニルオ  
キシ)-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0225】7-アセチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-  
メトキシ-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルア  
ミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-2 (1  
H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-メトキシ  
-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノ  
ン、7-アセチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒ  
ドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-  
アセチルアミノ-4-オクチルオキシ-3-ヒドロキシ  
-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0226】7-アセチルアミノ-3-オクチルオキシ  
-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノ  
ン、7-アセチルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-  
(2-プロベニルオキシ)-1-ブチル-2 (1H) -  
キノリノン、7-アセチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-  
(2-プロベニルオキシ)-1-ブチル-2 (1H)  
-キノリノン、7-アセチルアミノ-3-ゲラニルオキ  
シ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノ  
ン、

【0227】7-アセチルアミノ-4-ブトキシ-3-  
ゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノ  
ン、7-アセチルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘ  
キシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、  
7-アセチルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-(3-  
メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ブチル-2 (1

41

H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3, 4-ジガラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、  
 【0228】7-アセチルアミノ-3-ガラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0229】7-アセチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-4-ガラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3, 4-ジヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-アセトキシ-4-ブトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0230】7-アセチルアミノ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-アセトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-アセトキシ-4-ガラニルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0231】7-アセチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-4-ブトキシ-3-ホルミルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0232】7-アセチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ガラニルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3, 4-ジメトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-4-ブトキシ-3-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0233】7-アセチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-メトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1

42

H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-4-ガラニルオキシ-3-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0234】7-アセチルアミノ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-4-ブトキシ-3-イソプロポキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-イソプロポキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0235】7-アセチルアミノ-4-ガラニルオキシ-3-イソプロポキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-4-ヒドロキシ-3-イソプロポキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-ブトキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3, 4-ジブトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0236】7-アセチルアミノ-3-ブトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-ブトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3, 4-ジガラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-アセチルアミノ-3-ガラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0237】7-ベンゾイルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ヒドロキシ-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0238】7-ベンゾイルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-ブトキシ-4-ガラニルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-ブトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0239】7-ベンゾイルアミノ-3, 4-ジヘキシルオキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-(3-メ

チル-2-ブテニルオキシ)-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0240】7-ベンゾイルアミノ-4-メトキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ブトキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0241】7-ベンゾイルアミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ヒドロキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0242】7-ベンゾイルアミノ-4-メトキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0243】7-ベンゾイルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ヒドロキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-メトキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ブトキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0244】7-ベンゾイルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0245】7-ベンゾイルアミノ-4-ヒドロキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-ゲラニ

ルオキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0246】7-ベンゾイルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3, 4-ジゲラニルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0247】7-ベンゾイルアミノ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-ヒドロキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0248】7-ベンゾイルアミノ-3, 4-ジヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-アセトキシ-4-ブトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンゾイルアミノ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0249】7-シンナモイルアミノ-3-ブトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-シンナモイルアミノ-3-ブトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-シンナモイルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-シンナモイルアミノ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0250】7-シンナモイルアミノ-3, 4-ジヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-シンナモイルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-シンナモイルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0251】7-(3, 5-ジメトキシ-4-アセトキシシンナモイルアミノ)-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-

【0257】7-シンナモイルアミノ-4-(3-メチ 50

【0262】7-シンナモイルアミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-(4-ヒドロキシ-3-メトキシシンナモイルアミノ)-4-ヒドロキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2(1



H) -キノリノン、

【0263】7-シンナモイルアミノ-4-メトキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-4-ブトキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、

【0264】7-シンナモイルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-4-ヒドロキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、

【0265】7-シンナモイルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-3,4-ジゲラニルオキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、

【0266】7-シンナモイルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-(3,5-ジメトキシ-4-ヒドロキシシンナモイルアミノ)-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-(3,5-ジメトキシ-4-ヒドロキシシンナモイルアミノ)-3-ヒドロキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、

【0267】7-シンナモイルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-3,4-ジヒドロキシ-1-ヘキシル-2(1H)-キノリノン、7-シンナモイルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、7-(3,5-ジメトキシ-4-ヒドロキシシンナモイルアミノ)-3-アセトキシ-4-ブトキシ-1-オクチル-2(1H)-キノリノン、

【0268】7-シンナモイルアミノ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2(1H)-キノ

リノン、7-ベンジルアミノ-3-アセトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-アセトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0269】7-ベンジルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ブトキシ-3-ホルミルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0270】7-ベンジルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ゲラニルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-3,4-ジメトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ブトキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0271】7-ベンジルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-メトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0272】7-ベンジルアミノ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ブトキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-イソプロポキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0273】7-ベンジルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ヒドロキシ-3-イソプロポキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ブトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ベンジルアミノ-3,4-ジブトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0274】7-ベンジルアミノ-3-ブトキシ-4-

ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-プトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-プトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-プトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0275】7-ベンジルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-プトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3, 4-ジヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0276】7-ベンジルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-メトキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-プトキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0277】7-ベンジルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0278】7-ベンジルアミノ-4-ヒドロキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-メトキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-プトキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0279】7-ベンジルアミノ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3-オクチルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ヒドロキシ-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0280】7-ベンジルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-プロピル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-メトキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-プトキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0281】7-ベンジルアミノ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3- (2-プロベニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ヒドロキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0282】7-ベンジルアミノ-4-プトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3, 4-ジゲラニルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0283】7-ベンジルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-プトキシ-3-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0284】7-ベンジルアミノ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3-ヒドロキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ベンジルアミノ-3, 4-ジヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン等であり、また、本発明には、これら化合物の生理学的に許容される塩も含まれる。

【0285】ここでいう生理学的に許容される塩とは、上記に示される化合物の内で、水酸基を有するもの、特に3位及び/又は4位に水酸基を有するものについては、毒性を有さないアルカリ付加塩であり、例えば、ナトリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩、カルシウム塩、アンモニウム塩、無毒性のアミン塩等の無毒の塩が挙げられる。これらは公知の慣用の方法により製造でき

る。

【0286】また水酸基を有さないものについては、芳香環のアミノ基を鉍酸、例えば、塩酸、硫酸、リン酸により、または各種の有機酸、例えば、酢酸、プロピオン酸、コハク酸、酒石酸、マレイン酸、フマル酸、スルホン酸類としてメタンスルホン酸（メシル酸）等により無毒性の付加塩としたものが挙げられる。これらは公知の慣用の方法により製造できる。

【0287】また、一般式（I I）で示される本発明の 7-ニトロキノリノン誘導体は、本発明の 7-アミノキノリノン誘導体の合成中間体として重要であり、具体例としては、以下の化合物が挙げられる。7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ブトキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-2（1H）-キノリノン、

【0288】7-ニトロ-3-アセトキシ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ゲラニルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-メトキシ-2（1H）-キノリノン、

【0289】7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ホルミルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ゲラニルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-2（1H）-キノリノン、

【0290】7-ニトロ-3, 4-ジメトキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-メトキシ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-2（1H）-キノリノン、

【0291】7-ニトロ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-イソプロポキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-イソプロポキシ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロポキシ-2（1H）-キノリノン、

【0292】7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-イソプロポキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジブトキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ヘキシルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、

【0293】7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ゲラニルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ヒドロキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジヘキシルオキシ-2（1H）-キノリノン、

【0294】7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3-（2-メチルベンチルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-（2-メチルベンチルオキシ）-2（1H）-キノリノン、

【0295】7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-（2-メチルベンチルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-3-（2-メチルベンチルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-（2-メチルベンチルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-（2-メチルベンチルオキシ）-2（1H）-キノリノン、

【0296】7-ニトロ-4-メトキシ-3-オクチルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-3-オクチルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-2（1H）-キノリノン、

【0297】7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-オクチルオキシ-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3-（2-プロペニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-（2-プロペニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-（2-プロペニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、7-ニトロ-4-（3-メチル-2-ブテニルオキシ）-3-（2-プロペニルオキシ）-2（1H）-キノリノン、

【0298】7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-プロベニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-(2-プロベニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-プトキシ-3-ゲラニルオキシ-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘキシルオキシ-2(1H)-キノリノン、

【0299】7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-(3-メチル-2-プテニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3,4-ジゲラニルオキシ-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3,4-ジヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2(1H)-キノリノン、

【0300】7-ニトロ-4-プトキシ-3-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4-(3-メチル-2-プテニルオキシ)-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0301】7-ニトロ-3-アセトキシ-4-エトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-プトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-(3-メチル-2-プテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0302】7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-プトキシ-3-ホルミルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0303】7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-(3-メチル-2-プテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3,4-ジメトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-プトキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0304】7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒ

ドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-メトキシ-4-(3-メチル-2-プテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0305】7-ニトロ-3-イソプロボキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-プトキシ-3-イソプロボキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロボキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-イソプロボキシ-4-(3-メチル-2-プテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0306】7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロボキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-イソプロボキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-プトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3,4-ジプトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-プトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0307】7-ニトロ-3-プトキシ-4-(3-メチル-2-プテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-プトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-プトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-プトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0308】7-ニトロ-3,4-ジヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-(3-メチル-2-プテニルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン、

【0309】7-ニトロ-4-メトキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-プトキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-メチル-2(1H)-キノリノン、7-ニトロ-4-(3-メチル-2-プテニルオキシ)-3-(2-メチルベンチルオキシ)-1-メチ

ル-2 (1H) -キノリノン、

【0310】7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-  
(2-メチルペンチルオキシ) -1-メチル-2 (1  
H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-  
(2-メチルペンチルオキシ) -1-メチル-2 (1  
H) -キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3-オ  
クチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、  
7-ニトロ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-1-  
メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘ  
キシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 10  
(1H) -キノリノン、

【0311】7-ニトロ-4-(3-メチル-2-ブテ  
ニルオキシ) -3-オクチルオキシ-1-メチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキ  
シ-3-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-オクチル  
オキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ  
トロ-4-メトキシ-3-(2-プロペニルオキシ) -  
1-メチル-2 (1H) -キノリノン、

【0312】7-ニトロ-4-ブトキシ-3-(2-ブ  
ロペニルオキシ) -1-メチル-2 (1H) -キノリ  
ノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-ブ  
ロペニルオキシ) -1-メチル-2 (1H) -キノリ  
ノン、7-ニトロ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキ  
シ) -3-(2-プロペニルオキシ) -1-メチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキ  
シ-3-(2-プロペニルオキシ) -1-メチル-2  
(1H) -キノリノン、

【0313】7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-(2-  
プロペニルオキシ) -1-メチル-2 (1H) -キノリ  
ノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ  
-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-  
4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-メチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキ  
シ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノ  
リノン、

【0314】7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-メチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキ  
シ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリ  
ノン、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1  
-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-  
ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -  
キノリノン、

【0315】7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒ  
ドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-  
ニトロ-3-ヒドロキシ-4-(3-メチル-2-ブテ  
ニルオキシ) -1-メチル-2 (1H) -キノリノン、  
7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1  
-メチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3、 50

4-ジヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノ  
ン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-  
エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0316】7-ニトロ-3-アセトキシ-4-エトキ  
シ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ  
-3-アセトキシ-4-ブトキシ-1-エチル-2 (1  
H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-  
ヘキシルオキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリ  
ノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-(3-メチル-  
2-ブテニルオキシ) -1-エチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ゲラニルオ  
キシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0317】7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒド  
ロキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ  
トロ-3-ホルミルオキシ-4-メトキシ-1-エチル-  
2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-  
3-ホルミルオキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリ  
ノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシ  
ルオキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0318】7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-エチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキ  
シ-4-ゲラニルオキシ-1-エチル-2 (1H) -キノ  
リノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ヒド  
ロキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ  
トロ-3、4-ジメトキシ-1-エチル-2 (1H) -  
キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-メトキシ  
-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0319】7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-メ  
トキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ  
トロ-3-メトキシ-4-(3-メチル-2-ブテニル  
オキシ) -1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-  
ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-1-エチ  
ル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロ  
キシ-3-メトキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリ  
ノン、7-ニトロ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ  
-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0320】7-ニトロ-4-ブトキシ-3-イソプロ  
ポキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ  
トロ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-1-  
エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-イ  
ソプロポキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキ  
シ) -1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ  
トロ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロポキシ-1-エ  
チル-2 (1H) -キノリノン、

【0321】7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-イソプ  
ロポキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-  
ニトロ-3-ブトキシ-4-メトキシ-1-エチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ニトロ-3、4-ジブトキ  
シ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ

57

ー3-ブトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-エチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4  
- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-エチル-  
2 (1H) -キノリノン、

【0322】7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ゲラニル  
オキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ  
トロ-3-ブトキシ-4-ヒドロキシ-1-エチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキ  
シ-4-メトキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノ  
ン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ- 10  
1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-  
3, 4-ジヘキシルオキシ-1-エチル-2 (1H) -  
キノリノン、

【0323】7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-エチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキ  
シ-3-ヘキシルオキシ-1-エチル-2 (1H) -キ  
ノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒド  
ロキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ  
トロ-4-メトキシ-3- (2-メチルベンチルオキ 20  
シ) -1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニト  
ロ-4-ブトキシ-3- (2-メチルベンチルオキシ)  
-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0324】7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-  
(2-メチルベンチルオキシ) -1-エチル-2 (1  
H) -キノリノン、7-ニトロ-4- (3-メチル-2  
-ブテニルオキシ) -3- (2-メチルベンチルオキ  
シ) -1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニト  
ロ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-メチルベンチルオ  
キシ) -1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ 30  
トロ-4-ヒドロキシ-3- (2-メチルベンチルオキ  
シ) -1-エチル-2 (1H) -キノリノン、

【0325】7-ニトロ-4-メトキシ-3-オクチル  
オキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ  
トロ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-1-エチル  
-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシル  
オキシ-3-オクチルオキシ-1-エチル-2 (1H)  
-キノリノン、7-ニトロ-4- (3-メチル-2-ブ  
テニルオキシ) -3-オクチルオキシ-1-エチル-2  
(1H) -キノリノン、

【0326】7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-オ  
クチルオキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、  
7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ  
-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-  
4-メトキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-エ  
チル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブト  
キシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-エチル-2  
(1H) -キノリノン、

【0327】7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-  
(2-プロベニルオキシ) -1-エチル-2 (1H) - 50

58

キノリノン、7-ニトロ-4- (3-メチル-2-ブテ  
ニルオキシ) -3- (2-プロベニルオキシ) -1-エ  
チル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラ  
ニルオキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-エチ  
ル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロ  
キシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-エチル-2  
(1H) -キノリノン、

【0328】7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-メ  
トキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ  
トロ-4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-エチル  
-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニル  
オキシ-4-ヘキシルオキシ-1-エチル-2 (1H)  
-キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-エチル-2  
(1H) -キノリノン、

【0329】7-ニトロ-3, 4-ジゲラニルオキシ-  
1-エチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3  
-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-エチル-2  
(1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-  
4-メトキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノン、  
7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-エチ  
ル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシ  
ルオキシ-3-ヒドロキシ-1-エチル-2 (1H) -  
キノリノン、

【0330】7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4- (3-  
メチル-2-ブテニルオキシ) -1-エチル-2 (1  
H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-  
3-ヒドロキシ-1-エチル-2 (1H) -キノリノ  
ン、7-ニトロ-3, 4-ジヒドロキシ-1-エチル-  
2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ  
-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノ  
ン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-エトキシ-1-  
ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0331】7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ブトキ  
シ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ  
-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ブチル-  
2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ  
-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチ  
ル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセト  
キシ-4-ゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -  
キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロ  
キシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0332】7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-メ  
トキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニ  
トロ-4-ブトキシ-3-ホルミルオキシ-1-ブチル  
-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミル  
オキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H)  
-キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-  
(3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2  
(1H) -キノリノン、

【0333】7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジメトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-メトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0334】7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-イソプロポキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0335】7-ニトロ-3-イソプロポキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロポキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-イソプロポキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジブトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0336】7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0337】7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0338】7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニト

ロ-4-ブトキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0339】7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0340】7-ニトロ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0341】7-ニトロ-4-ブトキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0342】7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3- (2-プロベニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0343】7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジゲラニルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-

1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、

【0344】7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3、4-ジヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0345】7-ニトロ-3-アセトキシ-4-エトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ブトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0346】7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ホルミルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0347】7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ゲラニルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3、4-ジメトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0348】7-ニトロ-4-ブトキシ-3-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-メトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0349】7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-イソプロポキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0350】7-ニトロ-3-イソプロポキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロポキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-イソプロポキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0351】7-ニトロ-3-ブトキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3、4-ジブトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0352】7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3、4-ジヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0353】7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0354】7-ニトロ-4-ブトキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0355】7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3- (2-メチルペンチルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0356】7-ニトロ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、



シ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-オクチルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3- (2-プロペニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0357】7-ニトロ-4-ブトキシ-3- (2-プロペニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3- (2-プロペニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -3- (2-プロペニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3- (2-プロペニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0358】7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3- (2-プロペニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0359】7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジゲラニルオキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、

【0360】7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジヒドロキシ-1-ヘキシル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0361】7-ニトロ-3-アセトキシ-4-エトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ブトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-アセトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0362】7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7

-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ホルミルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0363】7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ゲラニルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ホルミルオキシ-4-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジメトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0364】7-ニトロ-4-ブトキシ-3-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-メトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0365】7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-イソプロポキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-イソプロポキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-イソプロポキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0366】7-ニトロ-3-イソプロポキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-イソプロポキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-イソプロポキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0367】7-ニトロ-3-ブトキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジブトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4- (3-メチル-2-ブテニルオキシ) -1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0368】7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ゲラニルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ブトキシ-4-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キ

ノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0369】7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0370】7-ニトロ-4-ブトキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0371】7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-(2-メチルペンチルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0372】7-ニトロ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-オクチルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-メトキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0373】7-ニトロ-4-ブトキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0374】7-ニトロ-4-ヒドロキシ-3-(2-プロペニルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニト

ロ-4-ブトキシ-3-ゲラニルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-ヘキシルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0375】7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジゲラニルオキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、

【0376】7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ヘキシルオキシ-3-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4-(3-メチル-2-ブテニルオキシ)-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-4-ゲラニルオキシ-3-ヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン、7-ニトロ-3, 4-ジヒドロキシ-1-オクチル-2 (1H) -キノリノン

【0377】本発明の7-アミノキノリノン誘導体及びその生理学的に許容される塩（以下本発明化合物と称する）は、後述の実施例で示すように、即時型及び遅延型アレルギー反応を抑制する作用を有し、且つ低毒性であり、抗アレルギー剤として種々のアレルギー性疾患の治療又は予防に極めて有用である。

【0378】本発明にいうアレルギー性疾患とは、外因性又は内因性の抗原により生体の免疫機構が過剰に活性化された結果生じる疾患であり、例えば、即時型喘息、遅延型喘息、気管支喘息、小児喘息、過敏性肺臓炎、アトピー性皮膚炎、アレルギー接触性皮膚炎、蕁麻疹、湿疹、アレルギー性結膜炎、アレルギー性鼻炎、花粉症、食物アレルギー、アレルギー性胃腸炎、アレルギー性大腸炎、薬物アレルギー、自己免疫性疾患等が挙げられる。

【0379】本発明化合物を有効成分とする抗アレルギー剤は、経口（内服又は吸入）又は非経口投与（例えば静脈内投与、皮下投与、経皮投与又は直腸内投与等）することが出来、投与に際してはそれぞれの投与法に適した製剤形態に調製することが出来る。

【0380】かかる製剤は、その用途に応じて錠剤、カプセル剤、顆粒剤、細粒剤、散剤、トローチ剤、舌下錠、坐剤、軟膏剤、注射剤、乳剤、懸濁剤、シロップ剤等の製剤形態に調製することが出来る。

【0381】これらの調製に際しては、例えばこの種の薬剤に通常使用されている無毒の賦形剤、結合剤、崩壊剤、滑沢剤、保存剤、酸化防止剤、等張化剤、緩衝剤、コーティング剤、矯味剤、溶解補助剤、基剤、分散剤、安定化剤、着色剤等の添加剤を使用して公知の方法によ

り製剤化することが出来る。これらの無毒性の添加剤の具体例を以下に列举する。

【0382】まず、賦形剤としては、でんぷん及びその誘導体（デキストリン、カルボキシメチルスターチ等）、セルロース及びその誘導体（メチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース等）、糖類（乳糖、白等、ブドウ糖等）、ケイ酸及びケイ酸塩類（天然ケイ酸アルミニウム、ケイ酸マグネシウム）、

【0383】炭酸塩（炭酸カルシウム、炭酸マグネシウム、炭酸水素ナトリウム等）、水酸化アルミニウム・マグネシウム、合成ヒドロタルサイト、ポリオキシエチレン誘導体、モノステアリン酸グリセリン、モノオレイン酸ソルビタン等が挙げられる。

【0384】結合剤としては、でんぷん及びその誘導体（アルファー化デンプン、デキストリン等）、セルロース及びその誘導体（エチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、ヒドロキシプロピルメチルセルロース等）、アラビアゴム、トラガント、ゼラチン、糖類（ブドウ糖、白糖等）、エタノール、ポリビニルアルコール等が挙げられる。

【0385】崩壊剤としては、でんぷん及びその誘導体（カルボキシメチルスターチ、ヒドロキシプロピルスターチ等）、セルロース及びその誘導体（カルボキシメチルセルロースナトリウム、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース等）、炭酸塩（炭酸カルシウム、炭酸水素カルシウム等）、トラガント、ゼラチン、寒天等が挙げられる。

【0386】滑沢剤としては、ステアリン酸、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウム、タルク、ケイ酸及びその塩類（軽質無水ケイ酸、天然ケイ酸アルミニウム等）、酸化チタン、リン酸水素カルシウム、乾燥水酸化アルミニウムゲル、マクロゴール等が挙げられる。

【0387】保存剤としては、パラオキシ安息香酸エステル類、亜硫酸塩類（亜硫酸ナトリウム、ピロ亜硫酸ナトリウム等）、リン酸塩類（リン酸ナトリウム、ポリリン酸カルシウム、ポリリン酸ナトリウム、メタリン酸ナトリウム等）、アルコール類（クロロブタノール、ベンジルアルコール等）、塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゼトニウム、フェノール、クレゾール、クロロクレゾール、デヒドロ酢酸、デヒドロ酢酸ナトリウム、ソルビン酸グリセリン、糖類等が挙げられる。

【0388】酸化防止剤としては、亜硫酸塩類（亜硫酸ナトリウム、亜硫酸水素ナトリウム等）、ロンガリット、エリソルビン酸、レーアスコルビン酸、システイン、チオグリセロール、ブチルヒドロキシアニゾール、ジブチルヒドロキシトルエン、没食子酸プロピル、アスコルビン酸パルミテート、d l -  $\alpha$  - トコフェロール等が挙げられる。

【0389】等張化剤としては、塩化ナトリウム、硝酸

ナトリウム、硝酸カリウム、デキストリン、グリセリン、ブドウ糖等が挙げられる。また緩衝剤としては、炭酸ナトリウム、塩酸、ホウ酸、リン酸塩（リン酸水素ナトリウム等）等が挙げられる。

【0390】コーティング剤としては、セルロース誘導体（ヒドロキシプロピルセルロース、酢酸フタル酸セルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート等）、セラック、ポリビニルピロリドン、ポリビニルピリジン類（ポリ-2-ビニルピリジン、ポリ-2-ビニル-5-エチルピリジン等）、ポリビニルアセチルジエチルアミノアセテート、ポリビニルアルコールフタレート、メタアクリレート・メタアクリル酸共重合体等が挙げられる。

【0391】矯味剤としては、糖類（ブドウ糖、白糖、乳糖等）、サッカリンナトリウム、糖アルコール類等が挙げられる。また溶解補助剤としては、エチレンジアミン、ニコチン酸アミド、サッカリンナトリウム、クエン酸、クエン酸塩類、安息香酸ナトリウム、石鹼類、ポリビニルピロリドン、ポリソルベート類、ソルビタン脂肪酸エステル類、グリセリン、ポリプレングリコール、ベンジルアルコール等が挙げられる。

【0392】基剤としては、脂肪類（豚脂等）、植物油（オリーブ油、ゴマ油等）、動物油、ラノリン酸、ワセリン、パラフィン、ロウ、樹脂、ベントナイト、グリセリン、グリコール油、高級アルコール類（ステアリルアルコール、セタノール等）等が挙げられる。

【0393】分散剤として、アラビアゴム、トラガント、セルロース誘導体（メチルセルロース等）、ステアリン酸ポリエステル類、セスキオレイン酸ソルビタン、モノステアリン酸アルミニウム、アルギン酸ナトリウム、ポリソルベート類、ソルビタン脂肪酸エステル類等が挙げられる。また安定化剤としては、亜硫酸塩類（亜硫酸水素ナトリウム等）、窒素、二酸化炭素等が挙げられる。

【0394】また、かかる製剤中における本発明化合物の含有量は、その剤型に応じて異なるが、一般に0.01~100重量%の濃度で含有していることが望ましい。本発明の抗アレルギー剤の投与量は、対象とする人間をはじめとする温血動物の種類、症状の軽重、医師の判断等により広範囲に変えることが出来るが、一般に有効成分として、経口投与の場合は、体重1kg当たり1日に0.01~50mg、好ましくは、0.05~10mgである。

【0395】また非経口投与の場合は、体重1kg当たり1日に0.01~10mg、好ましくは0.01~5mg投与することが好ましい。また、上記投与量は1日1回又は数回に分けて投与することが出来、患者の症状の軽重、医師の診断に応じて適宜変えることが出来る。

【0396】次に、本発明に関わる7-アミノキノリノン誘導体及び7-ニトロキノリノン誘導体の製造方法の

69

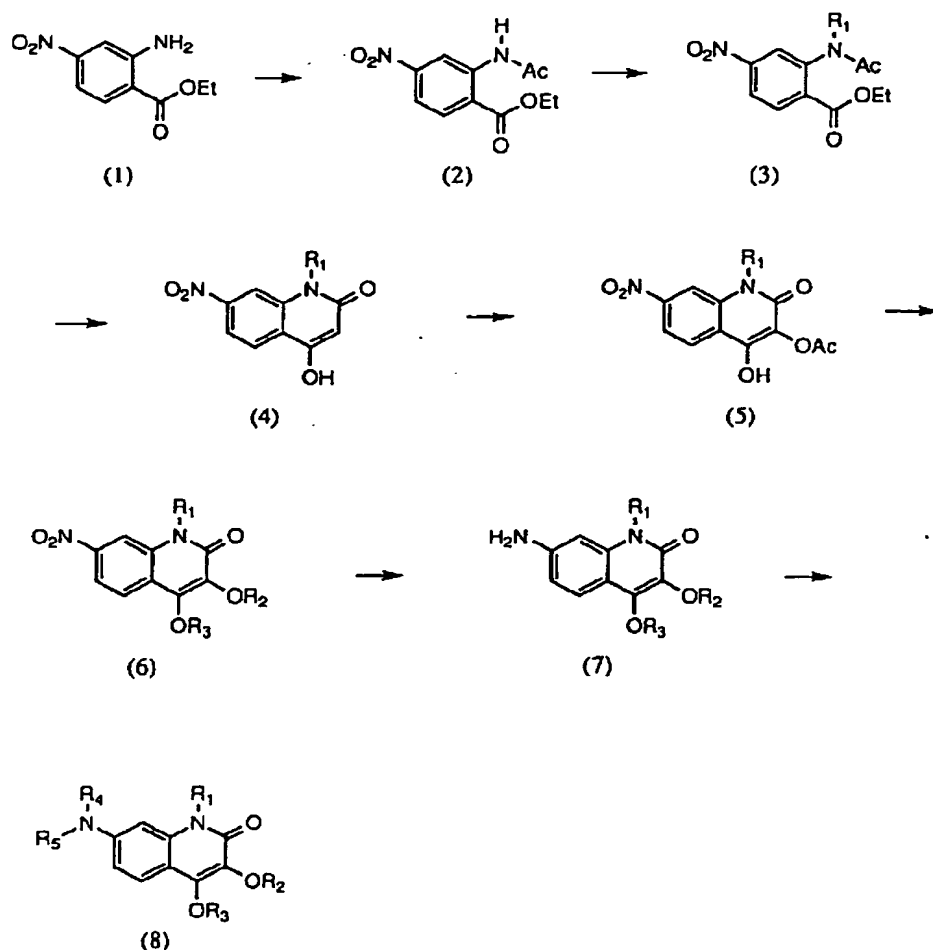
70

概略を説明する。本発明の一般式 (I) で表される 7-アミノキノリノン誘導体、及びその中間体である一般式 (I I) で表される 7-ニトロキノリノン誘導体は、以下の化 7 に示される反応経路に従って製造することができる。

【0397】尚、化 7 中の  $R_1 \sim R_4$  は上述の一般式 (I) 及び (I I) での定義と同じ意味を表す。

【0398】

【化 7】



【0399】先ず、第一工程として、4-ニトロアントラニル酸エチル (1) のアセチル化を行い、化合物

(2) とする。この反応で用いられるアセチル化剤は、通常のアセチル化反応に用いられる無水酢酸、塩化アセチル等が好ましい。反応温度は、 $0 \sim 120^\circ C$  で進行するが、好ましくは  $60 \sim 100^\circ C$  である。

【0400】反応時間は、用いる試薬の種類及び反応温度により異なるが、通常 30 分～3 時間である。また、反応を促進させる物質の添加は特に必要とはしないが、促進剤として塩基性物質を添加することもできる。塩基性物質としては、アミン類が好ましく、例えば、トリエチルアミン、ピリジン等が好適である。

【0401】次に、第二工程として、塩基性物質の存在下に、ハロゲン化アルキルを用い、化合物 (2) のアルキル化反応を行う。塩基性物質としては、炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の無機塩類、ナトリウムエトキシド、カリウム-*t*-ブトキシド等の

金属アルコラート、水素化ナトリウム等が挙げられる。この反応では、通常、反応溶媒として有機溶媒を用いる。

【0402】ここで用いる有機溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン等の炭化水素系溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン等のエーテル系溶媒、N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド系溶媒が好ましい。反応温度は、 $0 \sim 100^\circ C$ 、好ましくは、 $20 \sim 60^\circ C$  であり、反応時間は、通常 1～5 時間である。また、 $R_1$  が水素原子である化合物の場合には、ここでいうアルキル化反応を行わずに、下記の環化反応を行えばよい。

【0403】次に、第三工程として、化合物 (3) の環化反応を行い、環化生成化合物 (4) を得る。この反応は、化合物 (3) を有機溶媒中で塩基性物質と反応させることにより行う。用いられる塩基性物質としては、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム

40

50

-t-ブトキシド等の金属アルコラート類、水素化ナトリウム、水素化カリウム、リチウムジイソプロピルアミド、リチウムビス(トリメチルシリル)アミド等の塩基性物質が挙げられる。

【0404】この反応では、通常、有機溶媒を反応溶媒として用い、例えば、ベンゼン、トルエン等の炭化水素系溶媒、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、1,2-ジメトキシエタン等のエーテル系溶媒、N,N-ジメチルホルムアミド等のアミド系溶媒が好ましい。反応温度は、-50~100℃、好ましくは、0~50℃であり、反応時間は、通常1~5時間である。

【0405】次に、第四工程として、環化生成化合物(4)の3位のアシルオキシ化による酸化反応を行う。この酸化反応において用いられる酸化剤は、ヨードベンゼンジアセテートが好ましい。反応は有機酸中でヨードベンゼンジアセテートと直接反応させてもよいが、一旦、中間体であるヨードニウム塩を単離した後、有機酸との反応を行うことによって得られる。反応温度は、30~80℃が好適であり、反応時間は、通常2~5時間である。

【0406】次に、こうして得られた化合物(5)へのR<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>の導入は、R<sub>1</sub>が水素原子の場合は常法により脱アシル化を行えばよいし、R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>が水素原子以外の場合には適宜、保護基を導入することにより、アルキル化、アルケニル化を行なった後、必要に応じ脱保護反応を行えばよい。ここで、用いられる保護基は、通常水酸基の保護基として用いられる、例えばメトキシメチル基が挙げられる。このようにして、本発明の一般式(I I)で示される化合物を製造できる。

【0407】また、R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>の導入は、得られた化合物(6)のニトロ基を還元してアミノ基とし、化合物(7)とした後に、常法によりアシル化、アルキル化、アルケニル化、アラルキル化を行うことにより行われる。この際、3位あるいは4位に水酸基の存在する場合には、必要に応じ、保護基の導入が好ましい。

【0408】またニトロ基のアミノ基への還元反応は、水素ガス雰囲気下に、例えば、パラジウム、プラチナ等の金属触媒の存在下、有機溶媒中で攪拌を行うことにより行われる。ここで用いられる触媒量は、還元するニトロ化合物に対し1~10%重量程度用いればよい。反応時の水素ガスは、常圧ないしは加圧下で行なう。

【0409】反応温度は、0~100℃で行われるが、20~50℃が好ましい。反応時間は、通常、1~5時間である。また、還元反応は、例えば、スズ、亜鉛等の金属を用いても進行する。このようにして本発明の一般式(I)で示される化合物を製造することができる。

【0410】

【実施例】次に、実施例によって本発明を具体的に説明するが、もとより本実施例の範囲に、本発明の範囲が限

定されるものではない。

【0411】(参考例1)

2-アセチルアミノ-4-ニトロ安息香酸エチル(化合物1)

無水酢酸9mlに、4-ニトロアントラニル酸エチル4.45g(21.2mmol)を添加し、90℃にて、1時間加熱攪拌した。反応液を減圧濃縮し、得られた結晶を塩化メチレンとヘキサンの混合溶媒にて再結晶を行い、標題化合物(1)4.98gを得た。(収率93%)

【0412】<sup>1</sup>H-NMR(CDCI<sub>3</sub>, δ-TMS); 8.15(m, 3H), 6.05(bs, 1H), 4.43(q, 2H, J=7.0Hz), 1.82(s, 3H), 1.41(t, 3H)

IR(KBr, cm<sup>-1</sup>); 3240, 2850, 1740, 1550, 1345

【0413】(参考例2)

2-アセチルメチルアミノ-4-ニトロ安息香酸エチル(化合物2)

2-アセチルアミノ-4-ニトロ安息香酸エチル1.35g(5.4mmol)をDMF15mlに溶解し、水素化ナトリウム220mg(純度60%換算、5.5mmol)を氷冷下に添加し、15分間攪拌した。ヨウ化メチル1.50g(10.7mmol)を添加後、40分間攪拌した。

【0414】反応液に、ベンゼン、水を添加し、分液抽出を行い、有機層を減圧濃縮して、標題化合物の粗体を得た。これを酢酸エチルとヘキサンの混合溶媒にて再結晶を行い、標題化合物(2)1.16gを得た。(収率81%)

【0415】<sup>1</sup>H-NMR(CDCI<sub>3</sub>, δ-TMS); 8.15(m, 3H), 4.43(q, 2H, J=7.0Hz), 3.25(s, 3H), 1.82(s, 3H), 1.41(t, 3H)

IR(KBr, cm<sup>-1</sup>); 2850, 1740, 1550, 1345

【0416】(参考例3)

7-ニトロ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン(化合物3)

2-アセチルメチルアミノ-4-ニトロ安息香酸エチル1.48g(5.6mmol)を9mlのDMFに溶解し、220mg(純度60%換算、5.5mmol)の水素化ナトリウムを氷冷下に添加し、1晩攪拌した。反応液を20mlの水に添加し、4規定塩酸で酸性にした後、析出した結晶を濾過、乾燥し標題化合物(3)0.96gを得た。(収率78%)

【0417】<sup>1</sup>H-NMR(CDCI<sub>3</sub>, δ-TMS); 11.15(s, 1H), 8.21(m, 3H), 5.67(s, 1H), 3.55(s, 3H)

IR(KBr, cm<sup>-1</sup>); 3275, 1680, 155

5, 1345

【0418】(実施例1)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物4)

7-ニトロ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン 9.72 g (44.2 mmol) を 50 ml の塩化メチレンに添加し、ヨードベンゼンジアセテート 14.0 g (43.5 mmol) を添加後、室温にて3時間攪拌した。反応液を濾過し、得られた生成物を減圧乾燥し、中間物であるフェニルヨードニウム塩を 14.9

10

0 g 得た。  
【0419】これを 150 ml の酢酸に加え、70℃にて3時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、得られた粗生成物を塩化メチレンにて洗浄して、標題化合物 (4) 6.98 g を得た。(収率 56%)

【0420】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) ; 11.83 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.18 (d, 1H, J=7.2 Hz), 8.01 (d, 1H, J=7.2 Hz), 3.68 (s, 3H), 2.30 (s, 3H)

20

IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) ; 3275, 1745, 1680, 1555, 1345

元素分析値: C<sub>11</sub>H<sub>10</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub> として

計算値 (%) : C 51.80 ; H 3.62 ; N 10.07 ; O 34.51

実測値 (%) : C 51.75 ; H 3.67 ; N 10.26 ; O 34.32

【0421】(実施例2)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物5)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン 1.50 g (5.4 mmol) を 15 ml の DMF に添加し、炭酸カリウム 1.12 g (8.1 mmol)、ヨウ化メチル 0.76 g (5.4 mmol) を添加後、室温にて3時間攪拌した。反応液を水に添加し、ベンゼンにて抽出後、有機層を減圧濃縮して標題化合物 (5) の粗生成物を得た。シリカゲルクロマトグラフィー (溶離溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 1/1) で精製し、標題化合物 0.68 g を得た。

(収率 43%)

【0422】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) ; 8.27 (s, 1H), 8.18 (d, 1H, J=7.2 Hz), 8.01 (d, 1H, J=7.2 Hz), 4.32 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 2.30 (s, 3H)

IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) ; 1745, 1680, 1555, 1345

元素分析値: C<sub>11</sub>H<sub>11</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub> として

計算値 (%) : C 53.53 ; H 4.14 ; N 9.59 ; O 32.85

実測値 (%) : C 53.55 ; H 4.05 ; N 9.66 ; O 32.74

【0423】(実施例3)

7-アミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物6)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン 0.95 g (3.3 mmol) を 20 ml の THF に添加し、10%パラジウム炭素 95 mg の存在下に、水素雰囲気下、室温にて、3時間攪拌した。反応系を、窒素ガスにて置換後触媒を濾過し、濾液を減圧下にて濃縮した。得られた粗生成物をシリカゲルクロマトグラフィー (溶離溶媒: ヘキサン/酢酸エチル = 1/2) で精製し、標題化合物 (6) 0.75 g を得た。(収率 87%)

【0424】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) ; 7.95 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=7.2 Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2 Hz), 6.05 (bs, 2H), 4.32 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 2.30 (s, 3H)

【0425】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) ; 3280, 1745, 1675, 1250

元素分析値: C<sub>11</sub>H<sub>14</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub> として

計算値 (%) : C 59.53 ; H 5.38 ; N 10.68 ; O 24.40

実測値 (%) : C 59.55 ; H 5.45 ; N 10.66 ; O 24.34

【0426】(実施例4)

7-ニトロ-3,4-ジヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物7)

30

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン 2.56 g (9.2 mmol) を 50 ml のメタノールに添加し、更にナトリウムメトキシド 545 mg (10.1 mmol) のメタノール 2.5 ml 溶液を氷冷下に添加した。攪拌を1時間行い、4.4 g のアンバーリスト 15 を添加し、室温にて1時間攪拌した。固形物を濾過し、濾液を減圧濃縮して得られた粗生成物を、THF とヘキサンの混合溶媒にて再沈殿を行い標題化合物 (7) 1.76 g を得た。(収率 81%)

40

【0427】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) ; 11.18 (s, 1H), 10.85 (s, 1H), 8.05 (m, 3H), 3.68 (s, 3H)  
IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3280, 1605, 1550, 1345, 1250

元素分析値: C<sub>10</sub>H<sub>8</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub> として

計算値 (%) : C 50.81 ; H 3.41 ; N 11.86 ; O 33.87

実測値 (%) : C 50.85 ; H 3.45 ; N 11.66 ; O 34.04

50

【0428】(実施例5)

7-アミノ-3,4-ジヒドロキシ-1-メチル-2  
(1H)-キノリノン (化合物8)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンの代わりに、7-ニトロ-3,4-ジヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを用いる他は、実施例3と同様にして、標題化合物 (8) を得た。 (収率67%)

【0429】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 11.05 (s, 1H), 10.85 (s, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.78 (d, 1H, J=7.2 Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2 Hz), 5.97 (bs, 2H), 3.65 (s, 3H)

【0430】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3280, 1605, 1250

元素分析値: C<sub>11</sub>H<sub>10</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>として

計算値 (%) : C 58.25 ; H 4.89 ; N 13.58 ; O 23.28

実測値 (%) : C 58.55 ; H 4.75 ; N 13.66 ; O 23.04

【0431】 (実施例6)

7-メチルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物9)

7-アミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン0.95 g (3.6 mmol) を20 ml のDMFに添加し、炭酸カリウム0.55 g (4.0 mmol)、ヨウ化メチル0.56 g (4.0 mmol) を添加し、室温にて1時間攪拌した。反応液を水に加え、更にトルエンで抽出して、有機層を減圧濃縮した。残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離溶媒: ヘキサン/酢酸エチル=1/1) で精製して、標題化合物 (9) 0.45 g を得た。 (収率45%)

【0432】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 7.95 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=7.2 Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2 Hz), 5.86 (s, 1H), 4.32 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.45 (s, 3H), 2.30 (s, 3H)

【0433】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3280, 1745, 1675, 1250

元素分析値: C<sub>11</sub>H<sub>10</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>として

計算値 (%) : C 60.86 ; H 5.84 ; N 10.14 ; O 23.16

実測値 (%) : C 60.76 ; H 5.95 ; N 10.26 ; O 23.03

【0434】 (実施例7)

7-メチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物10)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンの代わりに、7-メチル

アミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを用いる他は、実施例4と同様にして、標題化合物 (10) を得た。 (収率75%)

【0435】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 10.45 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=7.2 Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2 Hz), 5.86 (s, 1H), 4.32 (s, 3H), 3.68 (s, 3H), 3.45 (s, 3H)

【0436】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3280, 1605, 1250

元素分析値: C<sub>11</sub>H<sub>10</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>として

計算値 (%) : C 61.52 ; H 6.02 ; N 11.96 ; O 20.49

実測値 (%) : C 61.43 ; H 5.98 ; N 11.96 ; O 20.63

【0437】 (実施例8)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-2 (1H)-キノリノン (化合物11)

7-ニトロ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンの代わりに、7-ニトロ-4-ヒドロキシ-2 (1H)-キノリノンを用いる他は、実施例1と同様にして、標題化合物 (11) を得た。 (収率61%)

【0438】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 11.45 (s, 1H), 9.56 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.18 (d, 1H, J=7.2 Hz), 8.01 (d, 1H, J=7.2 Hz), 2.30 (s, 3H)

【0439】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3275, 1745, 1680, 1555, 1345

元素分析値: C<sub>11</sub>H<sub>8</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>として

計算値 (%) : C 50.01 ; H 3.05 ; N 10.60 ; O 36.34

実測値 (%) : C 50.23 ; H 2.98 ; N 10.46 ; O 36.33

【0440】 (実施例9)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-2 (1H)-キノリノン (化合物12)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンの代わりに、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-2 (1H)-キノリノンを用いる他は、実施例2と同様にして、標題化合物 (12) を得た。 (収率41%)

【0441】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 9.56 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.18 (d, 1H, J=7.2 Hz), 8.01 (d, 1H, J=7.2 Hz), 4.15 (s, 3H), 2.15 (s, 3H)

【0442】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3245, 1730, 1650, 1555, 1345

77

元素分析値:  $C_{11}H_{10}N_2O_4$  として計算値(%) :  $C 51.80$  ;  $H 3.62$  ;  $N 10.07$  ;  $O 34.51$ 実測値(%) :  $C 51.83$  ;  $H 3.58$  ;  $N 10.36$  ;  $O 34.23$ 

【0443】(実施例10)

7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノン (化合物13)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノンの代わりに、7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-2 (1H) -キノリノンを用いる他は、実施例4と同様にして、標題化合物 (13) を得た。(収率79%)

【0444】 $^1H$ -NMR ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S) :  $10.89$  (s, 1H),  $9.56$  (s, 1H),  $8.27$  (s, 1H),  $8.18$  (d, 1H,  $J=7.2$  Hz),  $8.01$  (d, 1H,  $J=7.2$  Hz),  $4.15$  (s, 3H)【0445】IR (KBr,  $cm^{-1}$ ) :  $3245$ ,  $1600$ ,  $1555$ ,  $1345$ 元素分析値:  $C_{10}H_8N_2O_4$  として計算値(%) :  $C 50.85$  ;  $H 3.41$  ;  $N 11.86$  ;  $O 33.87$ 実測値(%) :  $C 50.83$  ;  $H 3.48$  ;  $N 11.76$  ;  $O 33.93$ 

【0446】(実施例11)

7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノン (化合物14)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノンの代わりに、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノンを用いる他は、実施例3と同様にして、標題化合物 (14) を得た。(収率66%)

【0447】 $^1H$ -NMR ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S) :  $10.89$  (s, 1H),  $9.56$  (s, 1H),  $7.95$  (s, 1H),  $7.85$  (d, 1H,  $J=7.2$  Hz),  $7.50$  (d, 1H,  $J=7.2$  Hz),  $5.86$  (s, 2H),  $4.15$  (s, 3H)【0448】IR (KBr,  $cm^{-1}$ ) :  $3245$ ,  $1605$ ,  $1250$ 元素分析値:  $C_{10}H_{10}N_2O_3$  として計算値(%) :  $C 58.25$  ;  $H 4.89$  ;  $N 13.58$  ;  $O 23.28$ 実測値(%) :  $C 58.28$  ;  $H 4.78$  ;  $N 13.76$  ;  $O 23.18$ 

【0449】(実施例12)

7-アミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノン (化合物15)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノンの代わりに、7-ニトロ-

78

3-アセトキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノンを用いる他は、実施例3と同様にして、標題化合物 (15) を得た。(収率68%)

【0450】 $^1H$ -NMR ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S) :  $9.56$  (s, 1H),  $7.95$  (s, 1H),  $7.85$  (d, 1H,  $J=7.2$  Hz),  $7.50$  (d, 1H,  $J=7.2$  Hz),  $5.86$  (s, 2H),  $4.15$  (s, 3H),  $2.14$  (s, 3H)【0451】IR (KBr,  $cm^{-1}$ ) :  $3245$ ,  $1730$ ,  $1680$ ,  $1250$ 元素分析値:  $C_{11}H_{11}N_2O_4$  として計算値(%) :  $C 58.06$  ;  $H 4.87$  ;  $N 11.29$  ;  $O 25.78$ 実測値(%) :  $C 58.18$  ;  $H 4.88$  ;  $N 11.16$  ;  $O 25.78$ 

【0452】(実施例13)

7-ブチルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノン (化合物16)

7-アミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン及びヨウ化メチルの代わりに、7-アミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノン及びヨウ化ブチルを用いる他は、実施例6と同様にして、標題化合物 (16) を得た。(収率75%)

【0453】 $^1H$ -NMR ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S) :  $9.56$  (s, 1H),  $7.90$  (s, 1H),  $7.85$  (d, 1H,  $J=7.2$  Hz),  $7.50$  (d, 1H,  $J=7.2$  Hz),  $6.04$  (m, 1H),  $4.15$  (s, 3H),  $3.34$  (m, 2H,  $J=7.5$  Hz),  $2.14$  (s, 3H),  $1.80 \sim 1.35$  (m, 4H),  $0.96$  (t, 3H,  $J=7.5$  Hz)【0454】IR (KBr,  $cm^{-1}$ ) :  $3245$ ,  $1734$ ,  $1680$ ,  $1250$ 元素分析値:  $C_{11}H_{10}N_2O_4$  として計算値(%) :  $C 63.14$  ;  $H 6.62$  ;  $N 9.21$  ;  $O 21.03$ 実測値(%) :  $C 63.18$  ;  $H 6.88$  ;  $N 9.16$  ;  $O 20.78$ 

【0455】(実施例14)

7-ブチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノン (化合物17)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノンの代わりに、7-ブチルアミノ-3-アセトキシ-4-メトキシ-2 (1H) -キノリノンを用いる他は、実施例4と同様にして、標題化合物 (17) を得た。(収率84%)

【0456】 $^1H$ -NMR ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S) :  $10.89$  (s, 1H),  $9.56$  (s, 1H),  $7.90$  (s, 1H),  $7.85$  (d, 1H,  $J=7.2$  Hz),  $7.50$  (d, 1H,  $J=7.2$  Hz),  $6.04$



(m, 1H), 4.15 (s, 3H), 3.34 (m, 2H, J=7.5Hz), 1.80~1.35 (m, 4H), 0.96 (t, 3H, J=7.5Hz)

【0457】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1610, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3$  として

計算値(%): C 64.10; H 6.92; N 10.68; O 18.30

実測値(%): C 64.18; H 6.98; N 10.56; O 18.28

【0458】(実施例15)

7-ニトロ-3-メトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物18)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン 3.2 g (11.5 mmol) を 64 ml の THF に添加し、トリエチルアミン 1.87 g (18.5 mmol) を添加後、クロロメチルメチルエーテル 1.89 g (23.0 mmol) を滴下し、室温にて1時間攪拌した。反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮して、3.6 g の 7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシメトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを得た。

【0459】次に、実施例4における7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンの代わりに、得られた生成物を用いて、7-ニトロ-3-ヒドロキシ-4-メトキシメトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンとした。更に実施例2と同様にして、メチル化し、7-ニトロ-3-メトキシ-4-メトキシメトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンとした。

【0460】最後に、得られた7-ニトロ-3-メトキシ-4-メトキシメトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを、メタノール 40 ml に添加し、0.22 g のパラトルエンスルホン 1 水和物を添加し、室温にて1時間攪拌した。反応液に水を添加し、酢酸エチルで抽出した後、減圧乾燥し粗生成物を得た。これを、THF とヘキサンの混合溶媒より再結晶を行い、標題化合物 (18) 1.45 g を得た。(収率 54%)

【0461】 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{d}_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S): 11.29 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.18 (d, 1H, J=7.2Hz), 8.01 (d, 1H, J=7.2Hz), 3.98 (s, 3H), 3.56 (s, 3H)

【0462】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1600, 1550, 1345, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_4$  として

計算値(%): C 52.80; H 4.03; N 11.20; O 31.97

実測値(%): C 52.67; H 3.98; N 11.56; O 31.79

【0463】(実施例16)

7-アミノ-3-メトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物19)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-メトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンの代わりに、7-ニトロ-3-メトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを用いる他は、実施例3と同様にして、標題化合物 (19) を得た。(収率 78%)

【0464】 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{d}_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S): 10.89 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2Hz), 5.85 (m, 2H), 4.08 (s, 3H), 3.54 (s, 3H)

【0465】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1600, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3$  として

計算値(%): C 59.99; H 5.49; N 12.72; O 21.80

実測値(%): C 60.01; H 5.45; N 12.68; O 21.86

【0466】(実施例17)

7-アミノ-3-アセトキシ-4-エトキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物20)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを用い、ヨウ化メチルの代わりに、ヨウ化エチルを用いる他は、実施例2、実施例3と同様にして標題化合物 (20) を得た。(収率 56%)

【0467】 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{d}_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S): 7.95 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2Hz), 6.00 (bs, 2H), 4.12 (t, 2H, J=7.5Hz), 3.58 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 0.98 (t, 3H, J=7.5Hz)

【0468】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1745, 1600, 1245

元素分析値:  $\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_4$  として

計算値(%): C 60.86; H 5.84; N 10.14; O 23.16

実測値(%): C 60.85; H 5.95; N 9.96; O 23.24

【0469】(実施例18)

7-アミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物21)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを用い、ヨウ化メチルの代わりに、ヨウ化ヘキシルを用いて、実施例15及び実施例3と同様にして、標題化合物 (21) を得た。(収率 54%)

【0470】 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{d}_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM

81

S) : 10.89 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2Hz), 5.85 (m, 2H), 4.23 (d, 2H, J=7.6Hz), 3.54 (s, 3H), 1.98~1.45 (m, 8H), 1.05 (t, 3H, J=7.5Hz)

【0471】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) : 3200, 1590, 1220, 1100

元素分析値:  $\text{C}_{18}\text{H}_{21}\text{N}_2\text{O}_5$ として

計算値(%) : C 66.18 ; H 7.64 ; N 9.65 ; O 16.53

実測値(%) : C 66.18 ; H 7.58 ; N 9.56 ; O 16.68

【0472】(実施例19)

7-アミノ-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン (化合物22)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノンを用い、ヨウ化メチルの代わりに、ヨウ化オクチルを用いて、実施例15及び実施例3と同様にして、標題化合物(22)を得た。(収率47%)

【0473】 $^1\text{H}$ -NMR ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S) : 11.23 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2Hz), 5.85 (m, 2H), 4.23 (d, 2H, J=7.6Hz), 3.54 (s, 3H), 1.86~1.45 (m, 12H), 0.97 (t, 3H, J=7.5Hz)

【0474】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) : 3200, 1595, 1230, 1100

元素分析値:  $\text{C}_{18}\text{H}_{21}\text{N}_2\text{O}_5$ として

計算値(%) : C 67.90 ; H 8.23 ; N 8.80 ; O 15.08

実測値(%) : C 67.86 ; H 8.38 ; N 8.96 ; O 14.80

【0475】(実施例20)

7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン (化合物23)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノンを用い、ヨウ化メチルの代わりに、ヨウ化ヘキシルを用いて、実施例2、実施例3及び実施例4と同様にして、標題化合物(23)を得た。(収率54%)

【0476】 $^1\text{H}$ -NMR ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S) : 11.05 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2Hz), 5.85 (m, 2H), 4.23 (d, 2H, J=7.6Hz), 3.54 (s, 3H), 1.87~1.45 (m, 8H), 1.02 (t, 3H, J=7.5Hz)

82

【0477】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) : 3245, 1600, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{18}\text{H}_{19}\text{N}_2\text{O}_5$ として

計算値(%) : C 66.18 ; H 7.64 ; N 9.65 ; O 16.53

実測値(%) : C 66.13 ; H 7.58 ; N 9.56 ; O 16.73

【0478】(実施例21)

7-オクチルアミノ-3-メトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン (化合物24)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノンを用い、アミノ基のアルキル化にヨウ化メチルの代わりに、ヨウ化オクチルを用いて、実施例3、実施例6及び実施例15と同様にして、標題化合物(24)を得た。(収率54%)

【0479】 $^1\text{H}$ -NMR ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S) : 11.05 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2Hz), 5.78 (m, 1H), 4.23 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 3.45 (t, 2H, J=7.5Hz), 1.87~1.45 (m, 12H), 1.02 (t, 3H, J=7.5Hz)

【0480】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) : 3245, 1600, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{18}\text{H}_{21}\text{N}_2\text{O}_5$ として

計算値(%) : C 68.64 ; H 8.49 ; N 8.43 ; O 14.44

実測値(%) : C 68.53 ; H 8.58 ; N 8.56 ; O 14.33

30 【0481】(実施例22)

7-ジメチルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノン (化合物25)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H) -キノリノンを用い、アルキル化にヨウ化メチルの代わりに、ヨウ化ヘキシルを用いて、実施例3、実施例6及び実施例15と同様にして、標題化合物(25)を得た。(収率45%)

【0482】 $^1\text{H}$ -NMR ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S) : 11.05 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2Hz), 4.23 (t, 2H, J=7.8Hz), 3.54 (s, 3H), 3.45 (s, 6H), 1.87~1.45 (m, 8H), 0.98 (t, 3H, J=7.5Hz)

【0483】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) : 3245, 1600, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{18}\text{H}_{21}\text{N}_2\text{O}_5$ として

計算値(%) : C 67.90 ; H 8.23 ; N 8.80 ; O 15.08

50

実測値 (%) : C 67.83 ; H 8.38 ; N 8.66 ;  
O 15.13

【0484】 (実施例 23)

7-メチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-オクチルオキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物 26)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを用い、アルキル化にヨウ化メチルの代わりに、ヨウ化オクチルを用いる他は、実施例 2、実施例 3 及び実施例 6 と同様にして、標題化合物 (26) を得た。 (収率 58%)

【0485】  $^1\text{H-NMR}$  ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TMS) : 10.45 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 7.50 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 5.76 (m, 1H), 4.13 (t, 2H,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 3.56 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 1.87~1.45 (m, 12H), 0.98 (t, 3H,  $J=7.5\text{Hz}$ )

【0486】 IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) : 3245, 1600, 1250

元素分析値 :  $\text{C}_{17}\text{H}_{19}\text{N}_2\text{O}_5$  として

計算値 (%) : C 68.64 ; H 8.49 ; N 8.43 ;  
O 14.44

実測値 (%) : C 68.83 ; H 8.48 ; N 8.46 ;  
O 14.23

【0487】 (実施例 24)

7-ヘキシルアミノ-3-メトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物 27)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを用い、アルキル化にヨウ化メチルの代わりに、ヨウ化ヘキシルを用いる他は、実施例 3、実施例 6 及び実施例 15 と同様にして、標題化合物 (27) を得た。 (収率 48%)

【0488】  $^1\text{H-NMR}$  ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TMS) : 11.45 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 7.50 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 5.65 (m, 1H), 4.23 (s, 3H), 3.56 (s, 3H), 3.43 (m, 2H), 1.87~1.45 (m, 8H), 0.98 (t, 3H,  $J=7.5\text{Hz}$ )

【0489】 IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) : 3245, 1600, 1250

元素分析値 :  $\text{C}_{17}\text{H}_{21}\text{N}_2\text{O}_5$  として

計算値 (%) : C 67.08 ; H 7.95 ; N 9.20 ;  
O 15.77

実測値 (%) : C 67.05 ; H 7.88 ; N 9.36 ;  
O 15.71

【0490】 (実施例 25)

7-ブチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物 28)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを用い、アルキル化にヨウ化メチルの代わりにヨウ化ブチル及びヨウ化ヘキシルを用いる他は、実施例 2、実施例 3 及び実施例 6 と同様にして、標題化合物 (28) を得た。 (収率 52%)

【0491】  $^1\text{H-NMR}$  ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TMS) : 10.45 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 7.50 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 5.75 (m, 1H), 4.23 (t, 2H,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 3.56 (s, 3H), 3.43 (m, 2H), 1.87~1.45 (m, 12H), 0.95 (m, 6H)

【0492】 IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) : 3245, 1600, 1250

元素分析値 :  $\text{C}_{20}\text{H}_{23}\text{N}_2\text{O}_5$  として

計算値 (%) : C 69.33 ; H 8.73 ; N 8.09 ;  
O 13.85

実測値 (%) : C 69.23 ; H 8.88 ; N 8.26 ;  
O 13.63

20 【0493】 (実施例 26)

7-メチルアミノ-3-(2-プロペニルオキシ)-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物 29)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを用い、アルキル化にヨウ化メチルの代わりに臭化アリルを用いる他は、実施例 15 と同様にして、7-ニトロ-3-(2-プロペニルオキシ)-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを合成した。得られた化合物の物性値を以下に示す。

【0494】  $^1\text{H-NMR}$  ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TMS) : 11.05 (s, 1H), 8.05 (m, 3H), 5.90 (m, 1H), 5.35~5.20 (m, 2H), 4.57 (d, 2H,  $J=2.0\text{Hz}$ ), 3.68 (s, 3H)

【0495】 IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ) : 3280, 1605, 1550, 1345, 1250

元素分析値 :  $\text{C}_{17}\text{H}_{17}\text{N}_2\text{O}_5$  として

計算値 (%) : C 56.52 ; H 4.38 ; N 10.14 ;  
O 28.96

実測値 (%) : C 56.43 ; H 4.48 ; N 10.16 ;  
O 28.93

【0496】 上記の化合物を用い、実施例 3 及び実施例 6 と同様にして、標題化合物 (29) を得た。 (収率 49%)

$^1\text{H-NMR}$  ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TMS) : 11.25 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 7.50 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 5.92 (m, 1H), 5.75 (m, 1H), 5.25 (m, 2H), 4.58 (d, 2H,  $J=2.0$ )

85

Hz), 3.56 (s, 3H), 3.43 (s, 3H)  
 【0497】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1600, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3$  として

計算値(%): C 64.60; H 6.20; N 10.76; O 18.44

実測値(%): C 64.43; H 6.48; N 10.56; O 18.53

【0498】(実施例 27)

7-メチルアミノ-3-ブレニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物 30)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを用い、アルキル化に臭化アリルの代わりに臭化ブレニルを用いる他は、実施例 26 と同様にして、標題化合物 (30) を得た。(収率 64%)

【0499】 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{d}_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S): 11.25 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 7.50 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 5.75 (m, 1H), 5.35 (m, 1H), 4.56 (d, 2H,  $J=2.0\text{Hz}$ ), 3.56 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 1.75 (s, 3H), 1.70 (s, 3H)

【0500】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1680, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3$  として

計算値(%): C 66.64; H 6.99; N 9.72; O 16.65

実測値(%): C 66.43; H 6.98; N 9.87; O 16.72

【0501】(実施例 28)

7-メチルアミノ-3-ゲラニルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物 31)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを用い、アルキル化に臭化アリルの代わりに臭化ゲラニルを用いる他は、実施例 26 と同様にして、標題化合物 (31) を得た。(収率 58%)

【0502】 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{d}_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S): 11.25 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 7.50 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 5.75 (m, 1H), 5.35 (m, 1H), 5.10 (m, 1H), 4.57 (d, 2H,  $J=2.8\text{Hz}$ ), 3.53 (s, 3H), 3.43 (s, 3H), 2.10 (m, 4H), 1.75 (s, 3H), 1.68 (s, 3H), 1.60 (s, 3H)

【0503】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1605, 1250

86

元素分析値:  $\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3$  として

計算値(%): C 70.76; H 7.92; N 7.86; O 13.47

実測値(%): C 70.73; H 7.98; N 7.87; O 13.42

【0504】(実施例 29)

7-アミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-エチル-2 (1H)-キノリノン (化合物 32)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-エチル-2 (1H)-キノリノンを用い、ヨウ化メチルの代わりにヨウ化ヘキシルを用いる他は、実施例 15 及び実施例 3 と同様にして、標題化合物 (32) を得た。

(収率 54%)

【0505】 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{d}_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S): 10.89 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.85 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 7.50 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 5.85 (m, 2H), 4.23 (d, 2H,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 3.54 (d, 2H,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 1.98~1.45 (m, 8H), 1.05 (m, 6H)

【0506】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1600, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3$  として

計算値(%): C 67.08; H 7.95; N 9.20; O 15.77

実測値(%): C 67.18; H 7.88; N 9.26; O 15.68

【0507】(実施例 30)

7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-ブチロキシ-1-ブチル-2 (1H)-キノリノン (化合物 33)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H)-キノリノンを用い、ヨウ化メチルの代わりにヨウ化ブチルを用いる他は、実施例 2 及び実施例 3 と同様にして、標題化合物 (33) を得た。(収率 46%)

【0508】 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{d}_6$ -DMSO,  $\delta$ -TM S): 10.89 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.85 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 7.50 (d, 1H,  $J=7.2\text{Hz}$ ), 5.85 (m, 2H), 4.25 (d, 2H,  $J=7.6\text{Hz}$ ), 3.54 (d, 2H,  $J=7.8\text{Hz}$ ), 1.98~1.45 (m, 6H), 1.05 (m, 6H)

【0509】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1600, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{14}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_3$  として

計算値(%): C 66.18; H 7.64; N 9.65; O 16.53

実測値(%): C 66.08; H 7.78; N 9.46; O 16.68

【0510】(実施例 31)

7-アミノ-3-ヒドロキシ-4-デシルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン (化合物 34)  
7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノンを用い、ヨウ化メチルの代わりに、ヨウ化デシルを用いる他は、実施例 2 及び実施例 3 と同様にして、標題化合物 (34) を得た。

(収率 46%)

【0511】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 10.89 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=7.2 Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2 Hz), 5.85 (m, 2H), 4.25 (d, 2H, J=7.6 Hz), 3.54 (d, 2H, J=7.8 Hz), 2.04~1.23 (m, 18H), 1.05 (m, 6H)

【0512】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3245, 1600, 1250

元素分析値: C<sub>21</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>として

計算値(%) : C 70.55; H 9.15; N 7.48; O 12.82

実測値(%) : C 70.53; H 8.98; N 7.46; O 13.03

【0513】(実施例 32)

7-ジメチルアミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン (化合物 35)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノンを用い、アルキル化にヨウ化メチルの代わりにヨウ化ヘキシルを用いる他は、実施例 3、実施例 6 及び実施例 15 と同様にして、標題化合物 (35) を得た。(収率 45%)

【0514】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 11.05 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H, J=7.2 Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2 Hz), 4.23 (t, 2H, J=7.8 Hz), 3.54 (m, 2H), 3.45 (s, 6H), 1.97~1.45 (m, 12H), 0.98 (m, 6H)

IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3245, 1600, 1250

【0515】元素分析値: C<sub>21</sub>H<sub>28</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>として

計算値(%) : C 69.97; H 8.95; N 7.77; O 13.32

実測値(%) : C 69.93; H 8.88; N 7.66; O 13.53

【0516】(実施例 33)

7-ジメチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-メトキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン (化合物 36)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノンを用いる他は、実施例 2、実施例 3 及び実施例 6 と同様にして、標題化合物

(36) を得た。(収率 47%)

【0517】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 11.05 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H, J=7.2 Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2 Hz), 4.23 (s, 3H), 3.54 (m, 2H), 3.45 (s, 6H), 1.97~1.45 (m, 4H), 0.98 (d, 3H, J=7.9 Hz)

【0518】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3230, 1610, 1250

元素分析値: C<sub>18</sub>H<sub>21</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>として

計算値(%) : C 66.18; H 7.64; N 9.65; O 16.53

実測値(%) : C 66.19; H 7.78; N 9.66; O 16.37

【0519】(実施例 34)

7-メチルアミノ-3-ブレンルオキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン (化合物 37)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノンを用い、アルキル化に臭化アリルの代わりに臭化ブレンルを用いる他は、実施例 26 と同様にして、標題化合物 (37) を得た。(収率 57%)

【0520】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 11.25 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.78 (d, 1H, J=7.2 Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2 Hz), 5.75 (m, 1H), 5.35 (m, 1H), 4.56 (d, 2H, J=2.0 Hz), 3.56 (d, 2H, J=7.9 Hz), 3.43 (s, 3H), 1.78~1.23 (m, 4H), 1.75 (s, 3H), 1.70 (s, 3H), 0.97 (t, 3H, J=7.9 Hz)

【0521】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3245, 1605, 1250

元素分析値: C<sub>18</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>として

計算値(%) : C 69.06; H 7.93; N 8.48; O 14.53

実測値(%) : C 69.19; H 7.98; N 8.57; O 14.26

【0522】(実施例 35)

7-メチルアミノ-3-ヒドロキシ-4-ブレンルオキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノン (化合物 38)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-ブチル-2 (1H) -キノリノンを用い、アルキル化に臭化アリルの代わりに臭化ブレンルを用い、実施例 2、3 及び 6 と同様にして、標題化合物 (38) を得た。(収率 47%)

【0523】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 10.25 (s, 1H), 7.89 (s, 1H),

7.78 (d, 1H, J=7.2 Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2 Hz), 5.75 (m, 1H), 5.35 (m, 1H), 4.56 (d, 2H, J=2.0 Hz), 3.56 (d, 2H, J=7.9 Hz), 3.43 (s, 3H), 1.78~1.23 (m, 4H), 1.75 (s, 3H), 1.70 (s, 3H), 0.97 (t, 3H, J=7.9 Hz)

【0524】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1620, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{11}\text{H}_{18}\text{N}_2\text{O}_5$  として

計算値 (%): C 69.06; H 7.93; N 8.48; O 14.53

実測値 (%): C 69.21; H 7.95; N 8.57; O 14.27

【0525】(実施例 36)

7-アセチルアミノ-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物 39)

7-アミノ-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン 1.5 g (4.7 mmol) をピリジン 15 ml に溶解し、氷冷下にて、無水酢酸 0.48 g (4.7 mmol) を滴下し、1時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を 4 規定塩酸にて洗浄し、減圧濃縮した。得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離溶媒: ヘキサン/酢酸エチル=2/1) にて精製し、標題化合物 (39) 1.13 g を得た。(収率 67%)

【0526】 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{d}_6$ -DMSO,  $\delta$ -TMS) 10.28 (s, 1H), 10.23 (s, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.80 (d, 1H, J=7.2 Hz), 7.40 (d, 1H, J=7.2 Hz), 3.94 (d, 2H, J=7.6 Hz), 3.52 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.71~1.20 (m, 12H), 0.86 (t, 3H, J=7.5 Hz)

【0527】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1650, 1600, 1220

元素分析値:  $\text{C}_{18}\text{H}_{28}\text{N}_2\text{O}_4$  として

計算値 (%): C 66.64; H 7.83; N 7.77; O 17.76

実測値 (%): C 66.86; H 7.88; N 7.96; O 17.30

【0528】(実施例 37)

7-(4-アセトキシ-3, 5-ジメトキシシンナモイルアミノ)-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物 40)

7-アミノ-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン 1.5 g (4.7 mmol) をピリジン 15 ml に溶解し、氷冷下にて、4-アセトキシ-3, 5-ジメトキシシンナモイルクロリ

ド 1.33 g (4.7 mmol) を添加し、1時間攪拌した。反応液を水に注ぎ、酢酸エチルにて抽出した。有機層を 4 規定塩酸にて洗浄し、減圧濃縮した。得られた粗生成物を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶離溶媒: 塩化メチレン/酢酸エチル=2/1) にて精製し、標題化合物 (40) 1.70 g を得た。(収率 64%)

【0529】 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{d}_6$ -DMSO,  $\delta$ -TMS) : 10.50 (s, 1H), 10.21 (s, 1

10 H), 7.92 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=8.8 Hz), 7.50 (d, 1H, J=15.6 Hz), 7.49 (s, 1H), 6.93 (s, 2H), 6.75 (d, 1H, J=15.6 Hz), 3.92 (t, 2H, J=6.8 Hz), 3.82 (s, 6H), 3.54 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.68 (m, 2H), 1.25 (m, 10H), 0.86 (t, 3H, J=6.8 Hz)

【0530】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3550, 2940, 1725, 1600, 1515, 1250, 1100

元素分析値:  $\text{C}_{21}\text{H}_{30}\text{N}_2\text{O}_6$  として

計算値 (%): C 65.71; H 6.76; N 4.94; O 22.59

実測値 (%): C 65.86; H 6.68; N 4.96; O 22.50

【0531】(実施例 38)

7-(3, 5-ジメトキシ-4-ヒドロキシシンナモイルアミノ)-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物 41)

7-(4-アセトキシ-3, 5-ジメトキシシンナモイルアミノ)-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン 1.2 g (2.11 mmol) をメタノール 15 ml に溶解し、氷冷下にて、ナトリウムメトキシド 0.46 g (8.4 mmol) を添加し、1時間攪拌した。反応液にアンバーライト-15 1.8 g を添加し、室温にて 1 時間攪拌後、反応液を濾過し、濾液を減圧濃縮後得られた粗生成物を、THF-ヘキサンより再結晶を行い、標題化合物 (41) 0.79 g を得た。(収率 71%)

40 【0532】 $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{d}_6$ -DMSO,  $\delta$ -TMS) : 10.39 (s, 1H), 10.29 (s, 1H), 8.92 (s, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=8.8 Hz), 7.53 (d, 1H, J=15.6 Hz), 7.49 (s, 1H), 6.93 (s, 2H), 6.75 (d, 1H, J=15.6 Hz), 3.92 (t, 2H, J=6.8 Hz), 3.82 (s, 6H), 3.54 (s, 3H), 1.68 (m, 2H), 1.25 (m, 10H), 0.86 (t, 3H, J=6.8 Hz)

50 【0533】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3550, 29

40, 1600, 1515, 1250, 1100

元素分析値: C, H, N, O, として

計算値(%) : C 66.39 ; H 6.92 ; N 5.34 ;  
O 21.35実測値(%) : C 66.45 ; H 7.08 ; N 4.96 ;  
O 21.51

## 【0534】(実施例39)

7-(4-アセトキシ-3, 5-ジメトキシシンナモイル  
アルミノ)-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-  
メチル-2(1H)-キノリノン(化合物42)7-アミノ-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-  
メチル-2(1H)-キノリノンの代わりに、7-ア  
ミノ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチ  
ル-2(1H)-キノリノンを用いる他は、実施例37  
と同様にして、標題化合物(42)を得た。(収率62  
%)【0535】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TM  
S) : 10.50 (s, 1H), 10.21 (s, 1  
H), 7.92 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=  
8.8Hz), 7.50 (d, 1H, J=15.6Hz),  
7.49 (s, 1H), 6.93 (s, 2H), 6.75  
(d, 1H, J=15.6Hz), 3.92 (t, 2H,  
J=6.8Hz), 3.82 (s, 6H), 3.54  
(s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.68 (m, 2  
H), 1.25 (m, 6H), 0.86 (t, 3H, J=  
6.8Hz)【0536】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3550, 29  
40, 1725, 1600, 1515, 1250, 110  
0

元素分析値: C, H, N, O, として

計算値(%) : C 64.67 ; H 6.36 ; N 5.2  
0 ; O 23.76実測値(%) : C 64.85 ; H 6.46 ; N 5.1  
2 ; O 23.57

## 【0537】(実施例40)

7-(4-ヒドロキシ-3, 5-ジメトキシシンナモイ  
ルアルミノ)-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1  
-メチル-2(1H)-キノリノン(化合物43)7-(4-アセトキシ-3, 5-ジメトキシシンナモイ  
ルアルミノ)-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1  
-メチル-2(1H)-キノリノンの代わりに、7-  
(4-アセトキシ-3, 5-ジメトキシシンナモイルア  
ミノ)-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メ  
チル-2(1H)-キノリノンを用いる他は実施例38  
と同様にして、標題化合物(43)を得た。(収率74  
%)【0538】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TM  
S) : 10.39 (s, 1H), 10.29 (s, 1  
H), 8.92 (s, 1H), 7.99 (s, 1H),  
7.85 (d, 1H, J=8.8Hz), 7.53 (d,1H, J=15.6Hz), 7.49 (s, 1H), 6.9  
3 (s, 2H), 6.75 (d, 1H, J=15.6H  
z), 3.92 (t, 2H, J=6.8Hz), 3.  
82 (s, 6H), 3.54 (s, 3H), 1.68  
(m, 2H), 1.25 (m, 6H), 0.86 (t, 3  
H, J=6.8Hz)【0539】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3550, 29  
40, 1600, 1515, 1250, 1100

元素分析値: C, H, N, O, として

計算値(%) : C 65.31 ; H 6.50 ; N 5.6  
4 ; O 22.56実測値(%) : C 65.35 ; H 6.52 ; N 5.5  
9 ; O 22.54

## 【0540】(実施例41)

7-(4-アセトキシ-3-メトキシシンナモイルアル  
ミノ)-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチ  
ル-2(1H)-キノリノン(化合物44)4-アセトキシ-3, 5-ジメトキシシンナモイルクロ  
リドの代わりに、4-アセトキシ-3-メトキシシンナ  
モイルクロリドを用いる他は、実施例37と同様にし  
て、標題化合物(44)を得た。(収率58%)【0541】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TM  
S) : 10.50 (s, 1H), 10.18 (s, 1  
H), 7.92 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=  
8.8Hz), 7.65 (m, 2H), 7.50 (d, 1  
H, J=15.6Hz), 7.49 (s, 1H), 6.93  
(d, 1H, J=8.8Hz), 6.75 (d, 1H,  
J=15.6Hz), 3.92 (t, 2H, J=6.8H  
z), 3.82 (s, 3H), 3.54 (s, 3  
H), 2.21 (s, 3H), 1.68 (m, 2H),  
1.25 (m, 10H), 0.86 (t, 3H, J=6.  
8Hz)【0542】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3550, 29  
40, 1725, 1600, 1515, 1250, 110  
0

元素分析値: C, H, N, O, として

計算値(%) : C 67.14 ; H 6.76 ; N 5.22 ;  
O 20.87実測値(%) : C 66.96 ; H 6.68 ; N 5.16 ;  
O 21.20

## 【0543】(実施例42)

7-(4-ヒドロキシ-3-メトキシシンナモイルアル  
ミノ)-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチ  
ル-2(1H)-キノリノン(化合物45)7-(4-アセトキシ-3, 5-ジメトキシシンナモイ  
ルアルミノ)-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1  
-メチル-2(1H)-キノリノンの代わりに、7-  
(4-アセトキシ-3-メトキシシンナモイルアル  
ミノ)-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル  
-2(1H)-キノリノンを用いる他は、実施例38と同

様にして、標題化合物 (45) を得た。(収率 74%)

【0544】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 10.50 (s, 1H), 10.10 (s, 1H), 8.92 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=8.8Hz), 7.65 (m, 2H), 7.50 (d, 1H, J=15.6Hz), 7.49 (s, 1H), 6.93 (d, 1H, J=8.8Hz), 6.75 (d, 1H, J=15.6Hz), 3.92 (t, 2H, J=6.8Hz), 3.82 (s, 3H), 3.54 (s, 3H), 1.68 (m, 2H), 1.25 (m, 10H), 0.86 (t, 3H, J=6.8Hz)

【0545】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3550, 2940, 1600, 1515, 1250, 1100

元素分析値: C<sub>21</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>として

計算値(%) : C 67.99; H 6.93; N 5.66; O 19.41

実測値(%) : C 67.96; H 6.78; N 5.46; O 19.80

【0546】(実施例 43)

7-(2-プロペニルアミノ)-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン(化合物 46)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノンを用い、アミノ基のアルキル化剤として、臭化アリルを用いて、実施例 3、実施例 6 及び実施例 15 と同様にして、標題化合物 (46) を得た。(収率 37%)

【0547】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 11.23 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2Hz), 5.92 (m, 1H), 5.75 (m, 1H), 5.25 (m, 2H), 4.58 (d, 2H, J=2.0Hz), 4.23 (d, 2H, J=7.6Hz), 3.54 (s, 3H), 1.86~1.45 (m, 12H), 0.97 (t, 3H, J=7.5Hz)

【0548】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3245, 1605, 1250

元素分析値: C<sub>21</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>として

計算値(%) : C 70.36; H 4.44; N 7.82; O 13.39

実測値(%) : C 70.39; H 4.58; N 7.96; O 13.07

【0549】(実施例 44)

7-ベンジルアミノ-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン(化合物 47)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノンを用い、アミノ基のアルキル化剤として、塩化ベンジルを用いて、実施例 3、実

施例 6 及び実施例 15 と同様にして、標題化合物 (47) を得た。(収率 45%)

【0550】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 11.20 (s, 1H), 7.92~7.26 (m, 8H), 5.73 (m, 1H), 4.23 (d, 2H, J=7.6Hz), 3.85 (m, 2H), 3.54 (s, 3H), 1.86~1.45 (m, 12H), 0.97 (t, 3H, J=7.5Hz)

【0551】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3235, 1610, 1250

元素分析値: C<sub>21</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>として

計算値(%) : C 73.49; H 7.90; N 6.86; O 11.75

実測値(%) : C 73.39; H 8.08; N 6.96; O 11.57

【0552】(実施例 45)

7-ブレンリルアミノ-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン(化合物 48)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノンを用い、アミノ基のアルキル化剤として、臭化ブレンリルを用いて、実施例 3、実施例 6 及び実施例 15 と同様にして、標題化合物 (48) を得た。(収率 54%)

【0553】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 11.23 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.85 (d, 1H, J=7.2Hz), 7.50 (d, 1H, J=7.2Hz), 5.35 (m, 1H), 4.23 (d, 2H, J=7.6Hz), 3.85 (m, 3H), 3.54 (s, 3H), 1.86~1.45 (m, 12H), 1.75 (d, 6H, J=15Hz), 0.97 (t, 3H, J=7.5Hz)

【0554】IR (KBr, cm<sup>-1</sup>) : 3235, 1600, 1230

元素分析値: C<sub>21</sub>H<sub>24</sub>N<sub>2</sub>O<sub>5</sub>として

計算値(%) : C 71.47; H 8.87; N 7.25; O 12.42

実測値(%) : C 71.39; H 8.78; N 7.16; O 12.67

【0555】(実施例 46)

7-ベンゾイルアミノ-3-オクチルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノン(化合物 49)

7-ニトロ-3-アセトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2(1H)-キノリノンを用い、アミノ基のアシル化剤として、塩化ベンゾイルを用いて、実施例 3、実施例 6 及び実施例 15 と同様にして、標題化合物 (49) を得た。(収率 68%)

【0556】<sup>1</sup>H-NMR (d<sub>6</sub>-DMSO, δ-TMS) : 11.20 (s, 1H), 9.85 (s, 1H),



95

7.83~7.26 (m, 8H), 4.23 (d, 2H,  $J=7.6\text{ Hz}$ ), 3.54 (s, 3H), 1.86~1.45 (m, 12H), 0.95 (t, 3H,  $J=7.5\text{ Hz}$ )

【0557】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3235, 1725, 1665, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{18}\text{H}_{20}\text{N}_2\text{O}_4$  として

計算値(%): C 71.06; H 7.16; N 6.63; O 15.15

実測値(%): C 71.13; H 7.08; N 6.76; O 15.03

【0558】(実施例47)

7-アミノ-3-メトキシ-4-ベンゾイルオキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物50)

7-ニトロ-3-メトキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン 1.00 g (4.00 mmol) をピリジン 7 ml に溶解し、氷冷下にベンゾイルクロリド 0.675 g (4.80 mmol) を添加し、室温にて1時間攪拌した。反応液を、2N-塩酸 45 ml に注ぎ、酢酸エチル 25 ml で抽出した。有機層を水 20 ml で洗浄した後、硫酸マグネシウムで乾燥、減圧下に濃縮した。得られた、7-ニトロ-3-メトキシ-4-ベンゾイルオキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンを実施例3と同様にして、ニトロ基の還元を行い、標題化合物 (50) 0.70 g を得た。(収率56%)

【0559】 $^1\text{H-NMR}$  ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TMS) 7.90 (s, 1H), 7.85 (d, 1H,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 7.65~7.20 (m, 6H), 5.85

(m, 2H), 4.08 (s, 3H), 3.54 (s, 3H)

【0560】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3245, 1725, 1600, 1250

元素分析値:  $\text{C}_{17}\text{H}_{16}\text{N}_2\text{O}_4$  として

計算値(%): C 65.37; H 5.16; N 8.97; O 20.49

実測値(%): C 65.23; H 5.15; N 8.78; O 20.84

【0561】(実施例48)

7-アミノ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン (化合物51)

7-ニトロ-3-ヘキシルオキシ-4-ヒドロキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノン をヨウ化メチルの代わりに、ヨウ化ヘキシルを用いる他は、実施例2と同様にして、7-ニトロ-4-ブトキシ-3-ヘキシルオキシ-1-メチル-2 (1H)-キノリノンとした。更に、実施例3と同様にして、ニトロ基の還元を行い、標題化合物 (51) を得た。(収率57%)

【0562】 $^1\text{H-NMR}$  ( $d_6$ -DMSO,  $\delta$ -TMS): 7.90 (s, 1H), 7.85 (d, 1H,  $J=7.2\text{ Hz}$ ), 7.50 (d, 1H,  $J=7.2\text{ Hz}$ ),

96

5.85 (m, 2H), 4.25 (m, 4H), 3.54 (s, 3H), 1.98~1.45 (m, 12H), 1.05 (m, 6H)

【0563】IR (KBr,  $\text{cm}^{-1}$ ): 3200, 1590, 1220, 1100

元素分析値:  $\text{C}_{20}\text{H}_{26}\text{N}_2\text{O}_4$  として

計算値(%): C 69.33; H 8.73; N 8.09; O 13.85

実測値(%): C 69.18; H 8.58; N 8.06; O 14.18

【0564】(実施例49) マウス急性毒性試験

本実施例は、本発明のアミノキノリノン誘導体の安全性を確認するため行ったものである。以下に試験方法を説明する。

試験方法: マウス用胃ゾンデを用いて化合物6、8~10、14~17、19~51の各アミノキノリノン誘導体の1000及び2000 mg/kg を1群5匹のマウス (ICR系雄性 体重20~25 g) に強制経口投与した。

【0565】経口投与後、ケージ内にて7日間飼育し、死亡動物の有無及び一般状態を観察し、観察終了時のマウスの生存率より50%致死量 (LD50: mg/kg) を推定した。この結果、試験した全てのアミノキノリノン誘導体のLD50は1000 mg/kg 以上であり、アミノキノリノン誘導体は極めて安全性が高いことが判明した。

【0566】(実施例50) ラット受身皮膚アナフィラキシー (PCA) 反応による薬理試験

7-アミノキノリノン誘導体の抗アレルギー作用を確認するため、抗アレルギー作用の確認試験として広く用いられているラット受身皮膚アナフィラキシー反応による薬理試験を実施した。本動物モデルは即時型アレルギー、即ち抗原抗体反応が関与するモデルである。以下に試験方法を説明する。

【0567】(試験方法) ウイスター系雄性ラット (9週齢) の背部を刈毛し、抗ジニトロフェノール-アスカリス (DNP-As) 血清を0.05 ml づつ2カ所に皮内投与した。48時間後、0.5%メチルセルロースナトリウム (MC) に懸濁したキノリノン誘導体 (被験薬物) を100 mg/kg 経口投与し、その1時間後にトリニトロフェノール-アスカリス (TNP-As) 1 mg を含有する0.5%エバンスブルー生理食塩溶液 1 ml を尾静脈より投与してアレルギー反応を惹起した。

【0568】反応惹起30分後、ラットをエーテル麻酔下で放血致死させ、背部皮膚を剥離して皮膚内面の色素漏出斑の長径及び短径を測定し両者の平均値 (mm) を色素漏出量の指標とした。溶媒対照として被験薬物の代わりに0.5% MCのみを経口投与した群、及び陽性対照として、トラニラスト (Tranilast) を被験薬物と同

様の方法で200mg/kg経口投与した群を設けた。

【0569】試験結果は、式1によりPCA反応抑制率(%)を算出し、表1に示した。尚、試験には1群5匹のラットを用いた。本試験条件下において、PCA反応抑制率が40%以上であれば、明らかに即時型アレルギーを抑制していると考えられる。

【0570】

【式1】PCA反応抑制率(%) = [(溶媒対照群の色素漏出量 - 被験薬物群又は陽性群の色素漏出量) / 溶媒対照群の色素漏出量] × 100

【0571】

【表1】

化合物	抑制率 (%)	化合物No.	抑制率 (%)
6	46	30	44
8	48	31	46
9	45	32	44
10	42	33	40
14	44	34	40
15	41	35	45
16	42	36	41
17	45	37	42
19	44	38	40
20	41	39	50
21	60	41	53
22	57	43	49
23	44	44	50
24	46	45	41
25	47	46	46
26	41	47	40
27	45	48	50
28	42	49	46
29	45	トラニラスト	54

【0572】表1に示すごとく、アミノキノリノン誘導体の抑制率は40～60%であり、トラニラスト(54%)とほぼ同程度の即時型(1型)アレルギーの抑制作用を有することが確認された。この試験結果より、本発明化合物が即時型喘息、花粉症、アレルギー性皮膚炎等に対して有用な抗アレルギー剤であることが判る。

【0573】(実施例51) 塩化ピクリル誘発接触性皮膚炎による薬効試験

アミノキノリノン誘導体の遅延型アレルギー抑制作用を確認するため、従来より知られているマウス塩化ピクリル誘発接触性皮膚炎モデルによる薬理試験を実施した。本動物モデルは即時型アレルギー反応とは異なり、細胞性免疫が関与する代表的な遅延型アレルギーモデル(イムノロジー第15巻405-416頁1968年; Immunology, Vol. 15, P405-416, 1968)であり、従来の抗アレルギー剤では抑制出来ずステロイド剤で抑制出来る反応である。以下に試験方法を説明する。

【0574】(試験方法) マウスの腹部を刈毛し、その

翌日に7%(重量/容量)塩化ピクリル-アセトン溶液0.1mlを塗布し感作した。感作7日後、1%(重量/容量)塩化ピクリル-オリーブ油溶液を5μlづつ左側耳介皮膚の両面に塗布し反応を惹き起こした。反応惹起前及び反応惹起24時間後の左耳の厚さを測定し、式(2)に従って耳介膨張率(%)を求めた。

【0575】尚、本発明化合物(被験薬物)は0.5%メチルセルロース(MC)に懸濁し反応惹起1時間前及び16時間後の2回、20mg/kgを強制経口投与した。溶媒対照として被験薬物の代わりに0.5%MCのみを投与した群、及び陽性対照群としてステロイド剤のプレドニゾン10mg/kg又はトラニラスト200mg/kgを経口投与した群を設けた。

【0576】本実施例の結果は、溶媒対照群に対する抑制率(%)を式(3)により算出し表2に示した。尚、試験には1群10匹のマウスを用いた。本試験条件下において、皮膚炎症反応抑制率が30%以上であれば明らかに遅延型アレルギーを抑制していると考えられる。

【0577】

【式2】耳介膨張率(%) = [(反応惹起24時間後の左耳の厚さ - 反応惹起前の左耳の厚さ) / 反応惹起前の左耳の厚さ] × 100

【0578】

【式3】抑制率(%) = [(溶媒対照群の耳介膨張率 - 被験薬物群又は陽性対象群の耳介膨張率) / 溶媒対照群の耳介膨張率] × 100

【0579】

【表2】

化合物No.	抑制率(%)	化合物No.	抑制率(%)
6	43	31	45
8	41	32	48
9	43	33	40
10	40	34	37
14	38	35	46
15	40	36	40
16	36	37	45
17	43	38	37
19	45	39	48
20	43	41	50
21	51	43	53
22	55	44	53
23	41	45	44
24	44	46	55
25	48	47	48
26	39	48	53
27	46	49	43
28	37	ブレドニゾン	53
29	48	トラニラスト	6
30	52		

【0580】本実験モデルの反応惹起により、溶媒群では有意な左側耳介の膨張が認められた。これに対し、本発明化合物は約40～60%の耳介膨張抑制効果を示し、ブレドニゾン(53%)とほぼ同等の活性を有することが判明した。現在、抗アレルギー薬として広く用いられているトラニラストは遅延型アレルギーに対して治療効果が認められなかった。

【0581】この試験結果より本発明化合物が遅延型アレルギーに対して高い治療効果を有することが判明し、遅延型喘息等の難治性のアレルギー疾患に有用な抗アレルギー剤であることが判明した。

【0582】(実施例52) 抗原誘発即時型及び遅延型気道反応による薬効試験

本発明の化合物のうち、化合物21、化合物41及び化合物46に関して、即時型及び遅延型アレルギー抑制作用を確認するため、以下に抗原誘発即時型及び遅延型気道反応による薬効試験を実施した。

【0583】試験方法：モルモットに超音波ネブライザー(NE-UI2、オムロン株式会社)を用い、OVA(1%)を1日に10分間、連続8日間吸入させ感作した。最終感作の1週間後、超音波ネブライザーを用い、OVA(2%)を5分間吸入させた。惹起24時間前及び1時間前にmetyrapone(10mg/kg)を静脈内に、惹起30分前にpyrilamine(10mg/kg)を腹腔内に投与した。

【0584】測定は気道抵抗測定装置(Pulmos-I、株式会社MIPS)を用い、惹起1分後、2、4、5、6、7及び8時間後、更に23～24時間後に1回、それぞれ1分間測定した。なお、被験物質は抗原惹起1時間前及び抗原惹起3時間後の2回経口投与した。陽性対照物質(ブレドニゾン)は16時間前及び2時間前の2回経口投与した。本実施例の結果は、溶媒対照群との比較により抑制率(%)を算出し、表3に示した。尚、試験には1群8匹のモルモットを用いた。

50 【0585】

【表 3】

即時型喘息 モデル	抑制率 (%)			
mg / k g	化合物 2 1	化合物 4 1	化合物 4 6	プレニゾロン
5	2 0 %	2 6 %	3 0 %	—
1 0	3 0 %	3 1 %	2 8 %	3 5 %
2 0	3 1 %	4 3 %	3 3 %	—
遅延型喘息 モデル	抑制率 (%)			
mg / k g	化合物 2 1	化合物 4 1	化合物 4 6	プレニゾロン
5	2 3 %	3 9 %	3 2 %	—
1 0	3 9 %	5 4 %	4 4 %	5 1 %
2 0	4 8 %	8 4 %	5 3 %	—

【0586】表3に示すごとく、本発明化合物はプレドニゾロンとほぼ同等、もしくはそれ以上の即時型及び遅延型喘息の抑制作用を有することが確認された。

【0587】（実施例53）（5%散剤）

本発明化合物 50mg  
乳糖 950mg

計 1000mg

化合物6、7～10及び14～17の散剤の製造例を示す。乳鉢で、本発明化合物を粉碎し、それに乳糖を添加し、乳棒で粉碎しながら、充分混合し、化合物6、7～10及び14～17の5%散剤を製造した。

【0588】（実施例54）（10%散剤）

本発明化合物 100mg  
乳糖 900mg

計 1000mg

化合物19～30の散剤の製造例を示す。実施例53と同様の方法で化合物19～30の10%散剤を製造した。

【0589】（実施例55）（10%顆粒剤）

本発明化合物 300mg  
乳糖 2000mg  
でんぶん 670mg  
ゼラチン 30mg

（実施例57）（20mg錠）

本発明化合物 20mg  
6%ヒドロキシプロピルセルロース乳糖 75mg  
ステアリン酸タルク 2mg  
バレイショデンプン 3mg

計 3000mg

【0590】化合物31～39の顆粒剤の製造例を示す。乳鉢内で、本発明化合物を等量のでんぶんと混合粉碎した。これに乳糖、でんぶんの残分を加え混合した。別にゼラチン30mgに精製水1mlを加えて、加熱溶解し、冷後かき混ぜながらこれにエタノール1mlを加え、ゼラチン液としたものを調製し、先の混合物にゼラチン液を添加練合し、造粒した後、乾燥して整粒し、化合物31～39の顆粒剤を製造した。

【0591】（実施例56）（5mg錠）

本発明化合物 5mg  
乳糖 62mg  
でんぶん 30mg  
タルク 2mg  
ステアリン酸マグネシウム 1mg

計 100mg/錠

【0592】化合物40～51の錠剤の製造例を示す。乳鉢内で上記配合の20倍量を用いて5mg錠剤の製造をした。すなわち、本発明化合物100mgの結晶を粉碎し、それに乳糖及びでんぶんを加え混合する。10%でんぶんのりを上記の配合体に加え練合し、造粒する。乾燥後、タルク及びステアリン酸マグネシウムを混合し、常法により打錠して、化合物40～51の錠剤を製造した。

【0593】

## 計

【0594】化合物40～43の錠剤の製造例を示す。上記記載の10倍量を用いて、20mg錠剤を製造した。すなわち、ヒドロキシプロピルセルロース6gを適量のエタノールに溶解し、これに乳糖94gを添加して練合した。

【0595】少し乾燥した後、60号ふるいにて整粒し、6%ヒドロキシプロピルセルロース乳糖とした。またステアリン酸マグネシウムとタルクを1:4の割合で混合しステアリン酸タルクとした。本発明化合物、6%ヒドロキシプロピルセルロース乳糖、ステアリン酸タルク及びバレイショデンプンをよく混合し、常法により打錠して、化合物40～43の錠剤を製造した。

【0596】(実施例58)(25mg錠)

本発明化合物	25mg
乳糖	122mg
カルボキシメチルスターチ	50mg
タルク	2mg
ステアリン酸マグネシウム	1mg

計 200mg/錠

【0597】化合物21、22、30～32の錠剤の製造例を示す。乳鉢内で上記化合物の各々10倍量を用いて25mg錠剤を製造した。即ち、乳鉢内で250mgの本発明化合物の結晶を粉碎し、それに乳糖を加えながら充分混合した。カルボキシメチルスターチに適量の精製水を加え、上記の混合物に添加練合し造粒した。乾燥後、タルク及びステアリン酸マグネシウムを混合し、常法により打錠して、化合物21、22、30～32の錠剤を製造した。

【0598】(実施例59)(10mgカプセル剤)

本発明化合物 300mg

100mg/錠

乳糖	2000mg
でんぶん	670mg
ゼラチン	30mg

計 3000mg

【0599】化合物31～39のカプセル剤の製造例を示す。実施例55と同様の方法で顆粒を製造し、該顆粒100mgづつをカプセルに充填して、化合物31～39のカプセル剤を製造した。

【0600】(実施例60)(0.5%軟膏)

本発明化合物	5mg
流動パラフィン	80mg
白色ワセリン	915mg

計 1000mg

【0601】化合物21、30、41～44の軟膏剤の製造例を示す。本発明化合物と少量の流動パラフィンを乳鉢で研和して分散液とし、これを別に白色ワセリンと流動パラフィンを加温混合して製した基剤に徐々に加えて、よく練り合わせ全質均等として製した。以上の操作にて化合物21、30、41～44の軟膏剤を製造した。

【0602】

【発明の効果】本発明は、新規なニトロキノリノン誘導体、該ニトロキノリノン誘導体から合成されるアミノキノリノン誘導体及びその生理学的に許容される塩、更に、該アミノキノリノン誘導体及びその生理学的に許容される塩を有効成分とする、安全性の高い医薬品、特に即時型アレルギー性疾患及び遅延型アレルギー性疾患に対して有効な、極めて優れた抗アレルギー剤を提供することができる。

フロントページの続き

(72)発明者 中西 滋典  
千葉県佐倉市大崎台3-18-9

(72)発明者 木村 信之  
千葉県佐倉市大崎台3-4-5-4-102  
(72)発明者 江田 昭英  
岐阜県岐阜市福光東3-8-20